



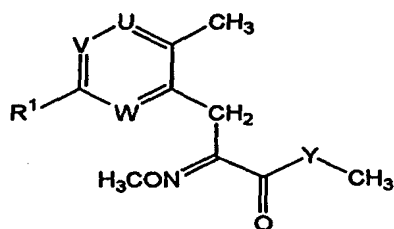
PCT

特許協力条約に基づいて公開された国際出願

<p>(51) 国際特許分類7 C07C 251/40, C07F 7/10, C07D 213/56, 213/61, 213/65, 213/64, 213/55, 307/52, 231/12, 215/12, 333/24, 333/60, 333/28, 239/26, 263/32, 207/325, 277/30, 277/70, A01N 37/50, 43/40, 43/54, 55/00</p>	<p>A1</p>	<p>(11) 国際公開番号 WO00/41999</p> <p>(43) 国際公開日 2000年7月20日(20.07.00)</p>
<p>(21) 国際出願番号 PCT/JP00/00060</p> <p>(22) 国際出願日 2000年1月11日(11.01.00)</p> <p>(30) 優先権データ 特願平11/5218 1999年1月12日(12.01.99) JP 特願平11/226308 1999年8月10日(10.08.99) JP</p> <p>(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 住友化学工業株式会社 (SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED)[JP/JP] 〒541-0041 大阪府大阪市中央区北浜四丁目5番33号 Osaka, (JP)</p> <p>(72) 発明者 ; および (75) 発明者 / 出願人 (米国についてのみ) 木下義晴(KINOSHITA, Yoshiharu)[JP/JP] 〒562-0046 大阪府箕面市桜ヶ丘4-9-17 Osaka, (JP) 阪口裕史(SAKAGUCHI, Hiroshi)[JP/JP] 〒561-0802 大阪府豊中市曽根東町2-11-8-407 Osaka, (JP) 真鍋明夫(MANABE, Akio)[JP/JP] 〒669-1546 兵庫県三田市弥生が丘6-1-6-503 Hyogo, (JP)</p>	<p>(74) 代理人 青山 稔, 外(AOYAMA, Tamotsu et al.) 〒540-0001 大阪府大阪市中央区城見1丁目3番7号 IMPビル 青山特許事務所 Osaka, (JP)</p> <p>(81) 指定国 AE, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW, 欧州特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG), ARIPO特許 (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM)</p> <p>添付公開書類 国際調査報告書</p>	

(54)Title: OXIME DERIVATIVES AND USES THEREOF

(54)発明の名称 オキシム誘導体及びその用途



(1)

(57) Abstract

Oxime derivatives represented by general formula (1) and having excellent plant disease controlling effects and insecticidal and acaricidal activities: wherein R^1 is optionally substituted C_1 - C_{10} alkyl or the like; one of U and V is CR^2 and the other is CH or N, and W is CR^3 or N (wherein R^2 and R^3 are each independently hydrogen, halogeno, C_1 - C_6 alkyl, or the like); and Y is oxygen or NH.

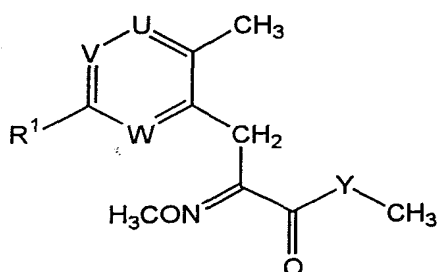
(57)要約

一般式 [1]

[式中、 R^1 は置換されていてもよいC1～C10アルキル基等を表わし、UおよびVの内、一つは CR^2 基を表わし、他の一つはCH基または窒素原子を表わし、Wは CR^3 基または窒素原子を表わし（ここで、 R^2 、 R^3 は同一または相異なり、水素原子、ハロゲン原子、C1～C6アルキル基等を表わす。）、Yは酸素原子またはNH基を表わす。]

で示されるオキシム誘導体。このオキシム誘導体は、優れた植物病害防除効力および殺虫、殺ダニ効力を有する。

[1] :



PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に掲載されたPCT加盟国を同定するために使用されるコード(参考情報)

AE	アラブ首長国連邦	DM	ドミニカ	KZ	カザフスタン	RU	ロシア
AG	アンティグア・バーブーダ	DZ	アルジェリア	LC	セントルシア	SD	スーダン
AL	アルバニア	EE	エストニア	LI	リヒテンシュタイン	SE	スウェーデン
AM	アルメニア	ES	スペイン	LK	スリ・ランカ	SG	シンガポール
AT	オーストリア	FI	フィンランド	LR	リベリア	SI	スロヴェニア
AU	オーストラリア	FR	フランス	LS	レソト	SK	スロヴァキア
AZ	アゼルバイジャン	GA	ガボン	LT	リトアニア	SL	シエラ・レオネ
BA	ボスニア・ヘルツェゴビナ	GB	英国	LU	ルクセンブルグ	SN	セネガル
BB	バルバドス	GD	グレナダ	LV	ラトヴィア	SZ	スワジランド
BE	ベルギー	GE	グルジア	MA	モロッコ	TD	チャード
BF	ブルキナ・ファソ	GH	ガーナ	MC	モナコ	TG	トーゴ
BG	ブルガリア	GM	ガンビア	MD	モルドヴァ	TJ	タジキスタン
BJ	ベナン	GN	ギニア	MG	マダガスカル	TM	トルクメニスタン
BR	ブラジル	GR	ギリシャ	MK	マケドニア旧ユーゴスラヴィア共和国	TR	トルコ
BY	ベラルーシ	GW	ギニア・ビサウ	ML	マリ	TT	トリニダード・トバゴ
CA	カナダ	HR	クロアチア	MN	モンゴル	TZ	タンザニア
CF	中央アフリカ	HU	ハンガリー	MR	モーリタニア	UA	ウクライナ
CG	コンゴ	ID	インドネシア	MW	マラウイ	UG	ウガンダ
CH	スイス	IE	アイルランド	MX	メキシコ	US	米国
CI	コートジボワール	IL	イスラエル	MZ	モザンビーク	UZ	ウズベキスタン
CM	カメルーン	IN	インド	NE	ニジェール	VN	ヴェトナム
CN	中国	IS	アイスランド	NL	オランダ	YU	ユーゴスラヴィア
CR	コスタ・リカ	IT	イタリア	NO	ノルウェー	ZA	南アフリカ共和国
CU	キューバ	JP	日本	NZ	ニュージーランド	ZW	ジンバブエ
CY	キプロス	KE	ケニア	PL	ポーランド		
CZ	チェッコ	KG	キルギスタン	PT	ポルトガル		
DE	ドイツ	KP	北朝鮮	RO	ルーマニア		
DK	デンマーク	KR	韓国				

明 細 書

オキシム誘導体及びその用途

発明の属する技術分野

本発明はオキシム誘導体及びその用途に関する。

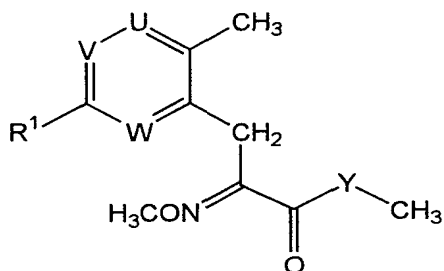
5 発明の開示

本発明の目的は、優れた植物病害防除効力および殺虫、殺ダニ効力を有する化合物を提供することである。

本発明者らは、鋭意検討した結果、下記一般式〔1〕で示されるオキシム誘導体が優れた植物病害防除効力および殺虫、殺ダニ効力を有することを見出し、本

10 発明を完成するに至った。

即ち、本発明によれば、上記目的は、一般式〔1〕：



〔式中、 R^1 はハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、置換されていてもよいC1～C10アルキル基、置換されていてもよいC3～C10シクロアルキル基、置換されていてもよいC5～C10シクロアルケニル基、置換されていてもよいC6あるいはC10アリール基、置換されていてもよいC1～C9ヘテロアリール基、 A^1-L^1 -基、 $A^1-C\equiv C$ -基、 $A^1C(A^2)=C(A^3)$ -基、 $A^1-ON=CA^2$ -基、 $A^1-ON=C(Me)CH_2ON=CA^2$ -基、 $A^1C(A^2)=NOCH_2$ -基、 $A^1SC(A^2)=N$ -基、 $A^1C(=S)NH$ -基、 $A^1SC(=S)NH$ -基、 $A^1SC(SA^2)=N$ -基、 $A^1-ON=C(CN)$ -基、 $A^1-ON=C(Me)CH_2ON=C(CN)$ -基または $A^1C(CN)=NOCH_2$ -基を表わし

{ここで、 L^1 は酸素原子、硫黄原子、カルボニル基、 $-OCH_2$ -基、 $-SCH_2$ -基、 $-C(=O)O$ -基、 $-OC(=O)-$ 基、 $-C(=O)OCH_2$ -基、 $-NH$ -基またはC1～C6アルキルイミノ基を表わし、

A^1 、 A^2 及び A^3 は同一または相異なり、水素原子、置換されていてもよい C 1
～C 10 アルキル基、置換されていてもよい C 2～C 10 アルケニル基、置換さ
れていてもよい C 2～C 10 アルキニル基、置換されていてもよい C 3～C 10
シクロアルキル基、置換されていてもよい C 5～C 10 シクロアルケニル基、置
5 換されていてもよい C 6 あるいは C 10 アリール基、置換されていてもよい C 7
～C 19 アリールアルキル基、置換されていてもよい C 1～C 9 ヘテロアリール
基、置換されていてもよい C 2～C 19 ヘテロアリールアルキル基、置換されて
いてもよい C 3～C 20 トリアルキルシリル基、置換されていてもよい C 8～C
20 ジアルキルアリールシリル基あるいは置換されていてもよい C 3～C 20 ジ
10 アルキルアルコキシシリル基を表わす。}、

U および V の内、一つは CR^2 基を表わし、他の一つは CH 基または窒素原子
を表わし、W は CR^3 基または窒素原子を表わし

{ここで、 R^2 、 R^3 は同一または相異なり、水素原子、ハロゲン原子、C 1～C
6 アルキル基、C 1～C 6 アルコキシ基、C 1～C 6 ハロアルキル基、C 1～C
15 6 ハロアルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C 2～C 6 アルコキシカルボニル
基、C 1～C 6 アルキルチオ基または C 1～C 6 ハロアルキルチオ基を表わ
す。}、

Y は酸素原子または NH 基を表わす。]

で示されるオキシム誘導体（以下、本発明化合物と記す。）及びそれを有効成
20 分として含有する農園芸用殺菌剤および殺虫、殺ダニ剤により達成される。

発明の実施の形態

本発明において、

R^1 、 A^1 、 A^2 及び A^3 で示される置換されていてもよい C 1～C 10 アルキル
基における C 1～C 10 アルキル基としては、例えばメチル基、エチル基、プロ
25 ピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、1-メチルプロピル基、ペ
ンチル基、1-メチルブチル基、1-エチルブチル基、2-メチルブチル基、3-
メチルブチル基、2, 2-ジメチルプロピル基、1, 2-ジメチルプロピル
基、1, 1-ジメチルプロピル基、ヘキシル基、1-メチルペンチル基、1-エ
チルペンチル基、3, 3-ジメチルブチル基、ヘプチル基、3, 7-ジメチルオ

クチル基等があげられ、

R^1 、 A^1 、 A^2 及び A^3 で示される置換されていてもよい C 3 ～ C 10 シクロアルキル基における C 3 ～ C 10 シクロアルキル基としては、例えばシクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基等があげられ、

- 5 R^1 、 A^1 、 A^2 及び A^3 で示される置換されていてもよい C 5 ～ C 10 シクロアルケニル基における C 5 ～ C 10 シクロアルケニル基としては、例えばシクロペンテニル基、シクロヘキセニル基等があげられ、

- 10 R^1 、 A^1 、 A^2 及び A^3 で示される置換されていてもよい C 6 あるいは C 10 アリール基における C 6 あるいは C 10 アリール基としては、フェニル基、 α -ナフチル基、 β -ナフチル基があげられ、

- 15 R^1 、 A^1 、 A^2 及び A^3 で示される置換されていてもよい C 1 ～ C 9 ヘテロアリール基における C 1 ～ C 9 ヘテロアリール基としては、例えば 2-ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、2-ピリミジニル基、4-ピリミジニル基、2-ピラジニル基、2-チエニル基、3-チエニル基、2-フリル基、3-フリル基、ピロール-1-イル基、1-ピラゾリル基、3-ピラゾリル基、4-ピラゾリル基、2-チアゾリル基、4-チアゾリル基、5-チアゾリル基、2-オキサゾリル基、5-オキサゾリル基、2-イミダゾリル基、3-(1, 2, 4-トリアゾリル) 基、2-ベンゾチエニル基、3-ベンゾチエニル基、ベンゾチアゾール-2-イル基、2-キノリニル基等があげられる。

- 20 A^1 、 A^2 及び A^3 で示される置換されていてもよい C 2 ～ C 10 アルケニル基における C 2 ～ C 10 アルケニル基としては、例えばビニル基、アリル基、1-メチル-2-プロペニル基、2-メチル-2-プロペニル基、2-ブテニル基、2-ペンテニル基、3-メチル-2-ブテニル基等があげられ、

- 25 A^1 、 A^2 及び A^3 で示される置換されていてもよい C 2 ～ C 10 アルキニル基における C 2 ～ C 10 アルキニル基としては、エチニル基、1-プロピニル基、3-メチル-1-プロピニル基等があげられ、

A^1 、 A^2 及び A^3 で示される置換されていてもよい C 7 ～ C 19 アリールアルキル基における C 7 ～ C 19 アリールアルキル基としては、ベンジル基、フェネチル基、ナフチルメチル基等があげられ、

A¹、A²及びA³で示される置換されていてもよいC 2～C 19ヘテロアリー
ルアルキル基における置換されていてもよいC 2～C 19ヘテロアリールアルキ
ル基としては、2-ピリジルメチル基、2-ピリミジニルメチル基、2-ピラジ
ニル基等があげられ、

- 5 A¹、A²及びA³で示される置換されていてもよいC 1～C 9トリアルキルシ
リル基における置換されていてもよいC 1～C 9トリアルキルシリル基として
は、トリメチルシリル基、トリエチルシリル基、エチルメチルプロピルシリル基
等があげられ、

- 10 A¹、A²及びA³で示される置換されていてもよいC 8～C 15ジアルキルア
リールシリル基における置換されていてもよいC 8～C 15ジアルキルアリー
ルシリル基としては、ジメチルフェニルシリル基、エチルメチルフェニルシリ
ル基、ジエチルフェニルシリル基等があげられ、

- 15 A¹、A²及びA³で示される置換されていてもよいC 3～C 20ジアルキルア
リールシリル基における置換されていてもよいC 3～C 20ジアルキルアリー
ルシリル基としては、エトキシジメチルシリル基、ジエチルメトキシシリル基等
があげられる。

更に、A⁴で示される置換されていてもよいC 6あるいはC 10アリール基に
おけるC 6あるいはC 10アリール基としては、フェニル基、 α -ナフチル基、
 β -ナフチル基があげられ、

- 20 A⁴で示される置換されていてもよいC 1～C 9ヘテロアリール基C 1～C 9
ヘテロアリール基としては、例えば2-ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリ
ジル基、2-ピリミジニル基、4-ピリミジニル基、2-ピラジニル基、2-チ
エニル基、3-チエニル基、2-フリル基、3-フリル基、ピロール-1-イル
基、1-ピラゾリル基、3-ピラゾリル基、4-ピラゾリル基、2-チアゾリル
25 基、4-チアゾリル基、5-チアゾリル基、2-オキサゾリル基、5-オキサゾ
リル基、2-イミダゾリル基、3-(1, 2, 4-トリアゾリル)基、2-ベン
ゾチエニル基、3-ベンゾチエニル基、ベンゾチアゾール-2-イル基、2-キ
ノリニル基等があげられ、

R¹、A¹、A²及びA³で示される置換されていてもよいC 3～C 10シクロア

ルキル基、置換されていてもよいC5～C10シクロアルケニル基、置換されていてもよいC6あるいはC10アリール基、置換されていてもよいC1～C9ヘテロアリール基、A¹、A²及びA³で示される置換されていてもよいC2～C10アルケニル基、置換されていてもよいC2～C10アルキニル基、置換されていてもよいC7～C19アリールアルキル基、置換されていてもよいC2～C19ヘテロアリールアルキル基、置換されていてもよいC1～C9トリアルキルシリル基、置換されていてもよいC8～C15ジアルキルアリールシリル基における置換基としては、例えば、

ハロゲン原子〔塩素原子、臭素原子、フッ素原子、ヨウ素原子〕、

- 10 C1～C10アルキル基〔例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、1-メチルプロピル基、ペンチル基、1-メチルブチル基、1-エチルブチル基、2-メチルブチル基、3-メチルブチル基、2,2-ジメチルプロピル基、1,2-ジメチルプロピル基、1,1-ジメチルプロピル基、ヘキシル基、1-メチルペンチル基、1-エチルペンチル基、
- 15 3,3-ジメチルブチル基、ヘプチル基、3,7-ジメチルオクチル基等〕、

C1～C10ハロアルキル基〔例えばトリフルオロメチル基、2,2,2-トリフルオロエチル基、1,1,2,2-テトラフルオロエチル基等〕、

C3～C10シクロアルキル基〔例えばシクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基等〕、

- 20 C1～C10アルコキシ基〔例えばメトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、イソプロポキシ基、n-ブトキシ基、sec-ブトキシ基、イソブトキシ基、n-ペンチルオキシ基等〕、

- C1～C10ハロアルコキシ基〔例えばトリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、プロモジフルオロメトキシ基、クロロジフルオロメトキシ基、フル
- 25 オロメトキシ基、2,2,2-トリフルオロエトキシ基、1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ基等〕、

C1～C10アルキルチオ基〔例えばメチルチオ基、エチルチオ基、n-プロピルチオ基、n-ブチルチオ基、イソブチルチオ基、sec-ブチルチオ基、n-ペンチルチオ基、n-ヘキシルチオ基等〕、

C 1 ~ C 1 0 ハロアルキルチオ基 [例えばトリフルオロメチルチオ基、ジフルオロメチルチオ基、ブロモジフルオロメチルチオ基、クロロジフルオロメチルチオ基、フルオロメチルチオ基、2, 2, 2-トリフルオロエチルチオ基、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチルチオ基等]、

- 5 C 2 ~ C 1 0 アルコキシカルボニル基 [メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、n-プロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基、n-ブトキシカルボニル基、イソブトキシカルボニル基、sec-ブトキシカルボニル基、n-ペンチルオキシカルボニル基、n-ヘキシルオキシカルボニル基等]、

- 10 C 2 ~ C 1 0 アルキルカルボニル基 [アセチル基、プロパノイル基、ブタノイル基等]、

C 2 ~ C 1 0 アルキルアミノ基 [メチルアミノ基、エチルアミノ基、イソプロピルアミノ基等]、

C 2 ~ C 1 0 アルキルアミノカルボニル基 [メチルアミノカルボニル基、エチルアミノカルボニル基等]、

- 15 C 2 ~ C 1 0 アルキルカルボニルアミノ基 [アセチルアミノ基、プロパノイルアミノ基、ブタノイルアミノ基等]、

- 20 フェニル基、フェノキシ基、ベンジルオキシ基、フェノキシメチル基、ヘテロアリール基、ヘテロアリールオキシ基、ヘテロアリールメトキシ基、ヘテロアリールオキシメチル基 {ここで、該フェニル基、フェノキシ基、ベンジルオキシ基、フェノキシメチル基、ヘテロアリール基、ヘテロアリールオキシ基、ヘテロアリールメチレンオキシ基およびヘテロアリールオキシメチレン基の各々は、ハロゲン原子 (例えば塩素原子等)、C 1 ~ C 6 アルキル基 (例えば、メチル基、エチル基等)、C 1 ~ C 6 アルコキシ基 (例えば、メトキシ基、エトキシ基等)、C 1 ~ C 6 ハロアルキル基 (例えば、トリフルオロメチル基等)、C 1 ~ C 6 ハロアルコキシ基 (例えば、トリフルオロメトキシ基等)、C 1 ~ C 6 アルキルチオ基 (例えば、メチルチオ基、エチルチオ基等)、C 1 ~ C 6 ハロアルキルチオ基 (例えば、トリフルオロメチルチオ基等) 及びシアノ基からなる群より選ばれる 1 種以上の基で置換されていてもよい。}、

C 3 ~ C 2 0 トリアルキルシリル基 [トリメチルシリル基、トリエチルシリル

基等]、

C 8 ~ C 2 0 ジアルキルアリールシリル基 [ジメチルフェニルシリル基、エチルメチルフェニルシリル基等]、

5 C 3 ~ C 2 0 ジアルキルアルコキシシリル基 [ジメチルエトキシシリル基、エチルメチルエトキシシリル基、ジメチルブトキシシリル基等]、

C 3 ~ C 2 0 アルキルジアルコキシシリル基 [ジ (イソプロピルオキシ) メチルシリル基等]、

C 7 ~ C 2 0 アルキルジシクロアルコキシシリル基 [ジ (シクロヘキシルオキシ) メチルシリル基、ジ (シクロヘキシルオキシ) エチルシリル基等]、

10 水酸基、シアノ基及びニトロ基等があげられ、

メチレンジオキシ基、ジフルオロメチレンジオキシ基 (ここで該メチレンジオキシ基およびジフルオロメチレンジオキシ基の各々は、アリール基上の隣接する二つの炭素原子に置換する。)、

15 R^2 及び R^3 で示されるハロゲン原子としては、例えば塩素原子、臭素原子等があげられ、

R^2 及び R^3 で示される、C 1 ~ C 6 アルキル基としては、例えばメチル基、エチル基等があげられ、

R^2 及び R^3 で示される C 1 ~ C 6 アルコキシ基としては例えばメトキシ基、エトキシ基等があげられ、

20 R^2 及び R^3 で示される C 1 ~ C 6 ハロアルキル基としては例えばトリフルオロメチル基等があげられ、

R^2 及び R^3 で示される C 1 ~ C 6 ハロアルコキシ基としては例えばトリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、ブロモジフルオロメトキシ基、クロロジフルオロメトキシ基、フルオロメトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ基等があげられ、

25 R^2 及び R^3 で示される C 2 ~ C 6 アルコキシカルボニル基としては例えばメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基等があげられ、

R^2 及び R^3 で示される C 1 ~ C 6 アルキルチオ基としては例えばメチルチオ基、エチルチオ基等があげられ、

R²及びR³で示されるC 1～C 6ハロアルキルチオ基としては例えばトリフル
 オロメチルチオ基、ジフルオロメチルチオ基、ブロモジフルオロメチルチオ基、
 クロロジフルオロメチルチオ基、フルオロメチルチオ基、2, 2, 2-トリフル
 オロエチルチオ基、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチルチオ基等があげら
 5 れ、

U、V及びWを含む6員芳香族環の具体例としてはベンゼン環、ピリジン環、
 ピリミジン環等があげられる。

本発明化合物にはC=N結合に基づく(E)及び(Z)の異性体が存在する
 が、その各々及びその混合物が本発明に含まれる。(ここで用いた(E)及び
 10 (Z)という用語は、広く幾何異性体を示すのに使用されているカーン-インゴ
 ールド-プレローグ則により定義されるものである。)

本発明化合物のうち、植物病害防除効力の点で好ましい置換基として、R¹と
 しては、置換されていてもよいフェニル基およびA¹-C≡C-基があげられ
 る。

15 本発明化合物のうち、植物病害防除効力の点で好ましいU、V及びWを含む6
 員芳香族環部位としては、U、V及びWが全てCH基である環があげられる。

本発明化合物のうち、植物病害防除効力の点でより好ましい化合物の例として、

N-メチル-3-(2-メチル-5-フェニル)フェニル-2-(メトキシイ
 ミノ)プロパンアミド [本発明化合物1]

20 N-メチル-3-{5-(3, 3-ジメチル-1-ブチニル)-2-メチ
 ル}フェニル-2-(メトキシイミノ)プロパンアミド [本発明化合物294]

N-メチル-3-{5-(3-メトキシ-3-メチル-1-ブチニル)-2-
 メチル}フェニル-2-(メトキシイミノ)プロパンアミド [本発明化合物35
 1]

25 があげられる。

本発明化合物のうち、殺虫、殺ダニ効力の点で好ましい置換基として、R¹と
 しては、A¹-C≡C-基があげられる。

本発明化合物のうち、殺虫、殺ダニ効力の点で好ましいU、V及びWを含む6
 員芳香族環部位としては、U、V及びWが全てCH基である環があげられる。

本発明化合物のうち、殺虫、殺ダニ効力の点でより好ましい化合物の例として、

N-メチル-3-{2-メチル-5-(2-トリエチルシリルエチニル)}フェニル-2-(メトキシイミノ)プロパンアミド [本発明化合物 251]

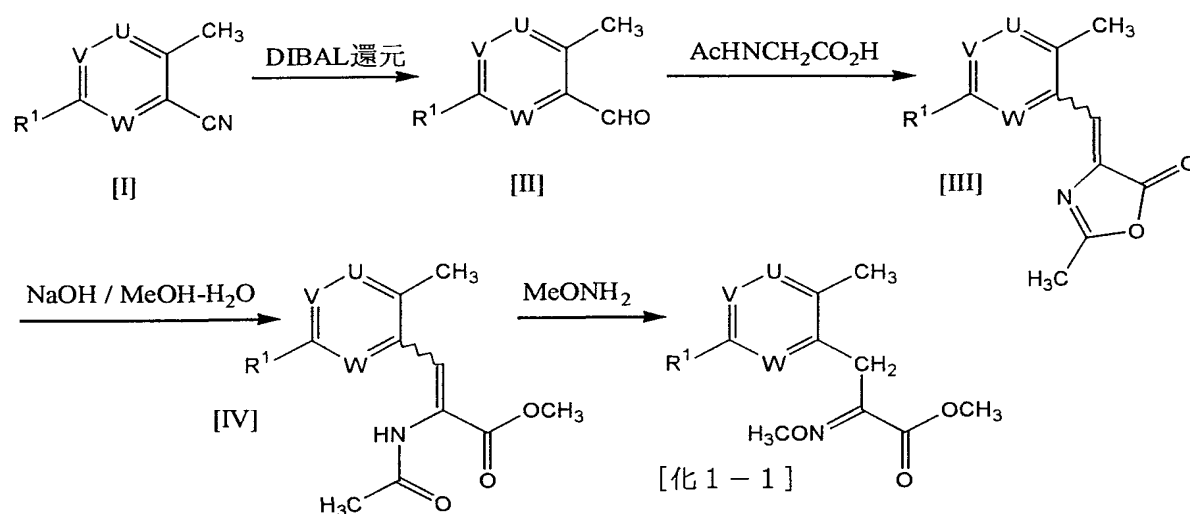
があげられる。

- 5 本発明化合物は例えば、下記製造法 A～製造法 J にしたがって製造することができる。これらの製造法においては必要に応じ官能基を反応から保護するために保護基を用いることができる。

製造法 A：一般式 [1] において Y が酸素原子である、一般式 [1-1] で示されるオキシムエステルの製造法

- 10 一般式 [1-1] で示されるオキシムエステルは例えばスキーム (1) に示す方法により、一般式 [I] で示される化合物から製造することが出来る。

スキーム (1)：



[式中、 R^1 、 U 、 V 及び W は前記と同じ意味を表わし、DIBALは水素化ジイソブチルアルミニウムを表わし、 Me はメチル基を、 Ac はアセチル基を表わす。]

(1) 一般式 [II] で示されるアルデヒド化合物の製造法

一般式 [II] で示されるアルデヒド化合物は、一般式 [I] で示されるニトリル化合物を、例えば水素化ジイソブチルアルミニウムを用いて還元することにより製造することができる。

- 20 (2) 一般式 [III] で示されるアザラクトン化合物の製造法

一般式[III]で示されるアザラクトン化合物は、一般式[II]で示されるアルデヒド化合物とN-アセチルグリシンとを、無水酢酸および酢酸ナトリウムの存在下にて反応させることにより製造することができる。

該反応の反応温度は通常100～200℃の範囲であり、反応時間は通常1～100時間の範囲である。

該反応に供される試剤の量は、一般式[II]で示されるアルデヒド化合物1モルに対して、N-アセチルグリシンは通常1～10モルの割合、酢酸ナトリウムは通常1～10モルの割合、無水酢酸は通常1～100モルの割合である。

反応終了後は例えば、反応液中の過剰の無水酢酸を留去した後、残さをクロマトグラフィーに付すか、あるいは反応液を水に注加した後、有機溶媒抽出、濃縮等の後処理を行い、目的化合物を得ることができる。該化合物は再結晶、クロマトグラフィー等により精製することができる。

一般式[IV]で示されるアミド化合物の製造法：

一般式[IV]で示されるアミド化合物は、一般式[III]で示されるアザラクトンとメタノールとを、水酸化ナトリウム水溶液の存在下に反応させることにより製造することができる。

該反応の反応温度は通常20～80℃の範囲であり、反応時間は通常1～100時間の範囲である。

該反応に供される試剤の量は、一般式[III]で示されるアザラクトン1モルに対してメタノールは通常1～1000モルの割合、水酸化ナトリウム水溶液は通常0.001～1モルの割合である。

反応終了後の反応液は、部分濃縮後、有機溶媒抽出する等の後処理を行い、目的化合物を得ることができる。該化合物は再結晶、クロマトグラフィー等により精製することもできる。

(4) 一般式[1-1]で示されるオキシムエステル化合物の製造法

一般式[1-1]で示されるオキシムエステル化合物は、一般式[IV]で示されるアミド化合物とメトキシアミンとを、酸の存在下に反応させることにより製造することができる。

該反応の反応温度は通常0～50℃の範囲であり、反応時間は通常1～100

時間の範囲である。

該反応に供される試剤の量は、一般式[IV]で示されるアミド化合物 1 モルに対してメトキシアミンは通常 1 ～ 20 モルの割合、酸は通常 0.1 ～ 3 モルの割合である。

- 5 メトキシアミンはそのまま、あるいは塩酸塩、硫酸塩等の塩として用いることもできる。

酸としては塩酸、硫酸などの無機酸、あるいは蔞酸、p-トルエンスルホン酸などの有機酸が挙げられる。

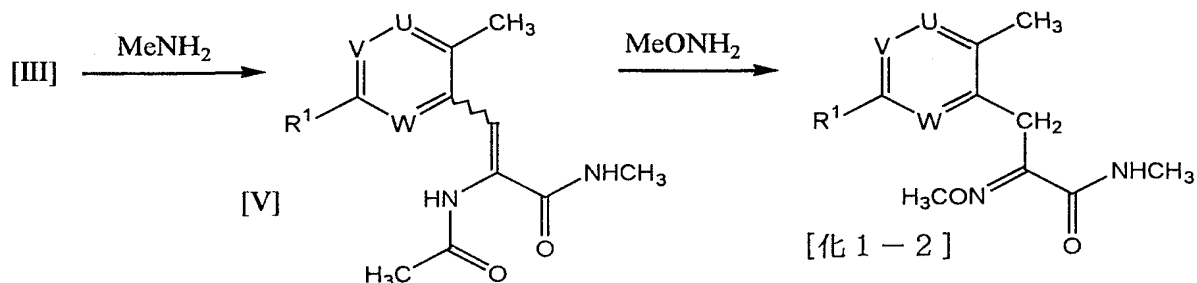
- 10 該反応は通常溶媒を用いて行ない、かかる溶媒としては、例えば、メタノール、エタノール等のアルコール類、n-ヘキサン、n-ヘプタン、リグロイン、石油エーテル等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、水等あるいはそれらの混合物があげられる。

- 15 反応終了後は例えば、反応液を水に注加した後、有機溶媒抽出、濃縮等の後処理を行い、目的化合物を得ることができる。該化合物は再結晶、クロマトグラフィー等により精製することもできる。

[製造法 B]：一般式 [1] において Y が NH 基である、一般式 [1-2] で示されるオキシムアミド化合物の製造法

例えば、スキーム (2) に示す方法により、一般式 [III] で示されるアザラク

- 20 トンから製造することが出来る。



[式中、R¹、U、V 及び W は前記と同じ意味を表わし、Me はメチル基を表わす。]

(1) 一般式 [V] で示されるジアミド化合物の製造法

一般式 [V] で示されるジアミド化合物は、一般式 [III] で示されるアザラク

とメチルアミンとを、反応させることにより製造することができる。

該反応の反応温度は通常 0 ～ 50℃ の範囲であり、反応時間は通常 1 ～ 100 時間の範囲である。

該反応に供される試剤の量は、一般式[III]で示されるアザラクトン化合物 1
5 モルに対してメチルアミンは通常 1 ～ 100 モルの割合である。

該反応は通常溶媒を用いて行ない、かかる溶媒としては、例えば 1, 4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、ジエチレングリコールジメチルエーテル、ジエチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル等のエーテル類、n-ヘキサン、n-ヘプタン、リグロイン、石油エーテル等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、水等あるいはそれらの混合物が挙げられる。
10

反応終了後は、反応液中に生じた結晶をろ過し、該結晶を乾燥するか、あるいは反応液を水に注加した後、有機溶媒抽出、濃縮等の後処理を行い、目的化合物を得ることができる。該化合物は再結晶、クロマトグラフィー等により精製することもできる。
15

(2) 一般式[1-2]で示されるオキシムアミド化合物の製造方法

一般式[1-2]で示されるオキシムアミド化合物は、一般式[V]で示されるジアミド化合物とメトキシアミンとを、酸の存在下に反応させることにより製造することができる。

20 該反応の反応温度は通常 20 ～ 120℃ の範囲であり、反応時間は通常 1 ～ 100 時間の範囲である。

該反応に供される試剤の量は、一般式[V]で示されるジアミド化合物 1 モルに対してメトキシアミンは通常 1 ～ 20 モルの割合、酸は通常 0.1 ～ 3 モルの割合である。

25 メトキシアミンはそのまま、あるいは塩酸塩、硫酸塩等の塩として用いることもできる。

酸としては塩酸、硫酸などの無機酸、あるいは蔞酸、p-トルエンスルホン酸などの有機酸が挙げられる。

該反応は通常溶媒を用いて行なう。かかる溶媒としては、例えば、メタノー

ル、エタノール等のアルコール類、*n*-ヘキサン、*n*-ヘプタン、リグロイン、石油エーテル等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、水等あるいはそれらの混合物があげられる。

5 反応終了後は例えば、反応液を水に注加した後、有機溶媒抽出、濃縮等の後処理を行い、目的化合物を得ることができる。該化合物は再結晶、クロマトグラフィー等により精製することもできる。

[製造法C]：一般式[1-1]で示されるオキシムエステルとメチルアミンとを有機溶媒中において反応させ、一般式[1-2]で示されるオキシムアミドを製造する方法

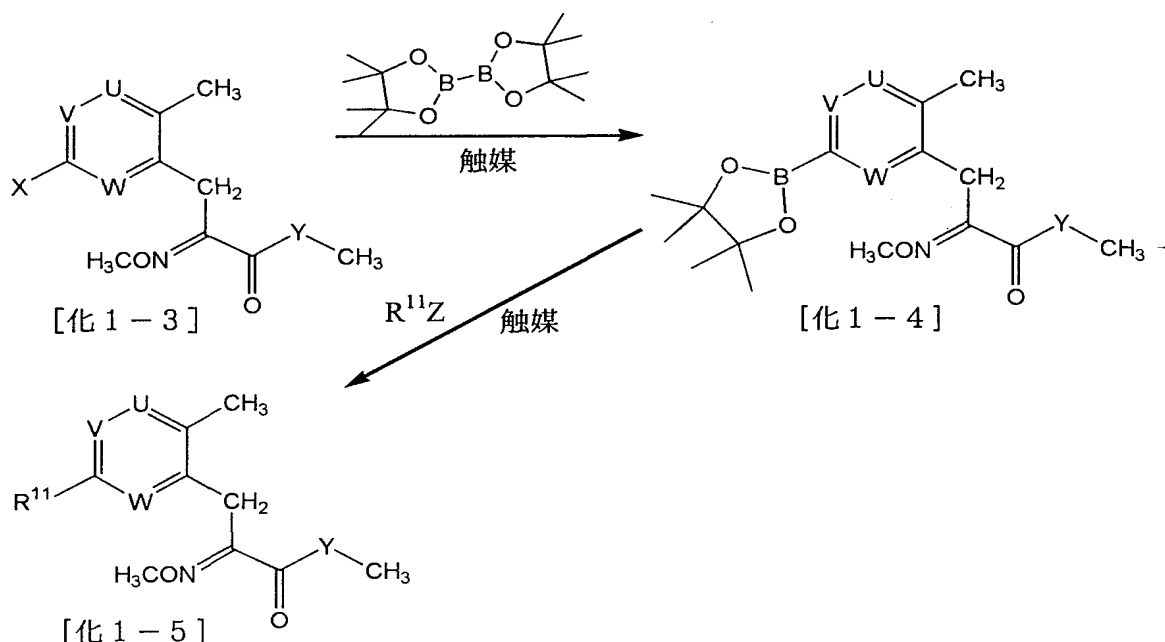
10 該反応の反応温度は通常-10～50℃の範囲であり、反応時間は通常1～100時間の範囲である。

該反応に供される試剤の量は、一般式[1-1]で示されるオキシムエステル1モルに対してメチルアミンは通常1～100モルの割合である。

15 該反応を溶媒中にて行なう場合、かかる溶媒としては、例えば1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、ジエチレングリコールジメチルエーテル、ジエチルエーテル、*tert*-ブチルメチルエーテル等のエーテル類、*n*-ヘキサン、*n*-ヘプタン、リグロイン、石油エーテル等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、水等あるいはそれらの混合物があげられる。

20 反応終了後は例えば、反応液を濃縮する等の後処理を行い、目的化合物を得ることができる。該化合物は再結晶、クロマトグラフィー等により精製することもできる。

[製造法D]：一般式[1]においてR¹が置換されていてもよいC₆あるいはC₁₀アリール基または置換されていてもよいC₁～C₉ヘテロアリール基である、一般式[1-5]で示されるオキシム化合物の製造法
25 スキーム(3)



[式中、 R^{11} は置換されていてもよいC6あるいはC10アリール基または置換されていてもよいC1～C9ヘテロアリール基を表わし、Zはハロゲン原子（塩素、臭素、沃素）を表わし、Xは臭素原子、沃素原子またはトリフルオロメタンスルホニルオキシ基を表わし、Y、U、VおよびWは前記と同じ意味を表わす。]

(1) 一般式[1-4]で示されるホウ酸エステル化合物の製造法

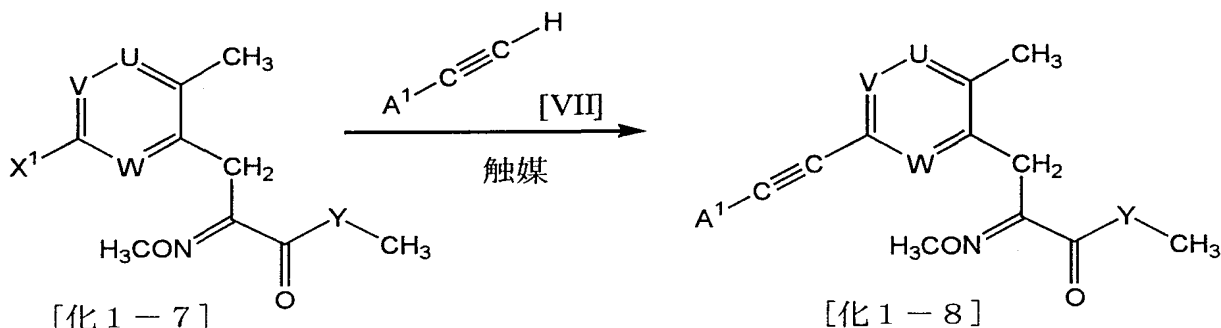
一般式[1-4]で示されるホウ酸エステル化合物は、一般式[1-3]で示されるハロゲン化物とビス（ピナコレート）ジボランとを、有機溶媒中（ジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミド等）、塩基（酢酸カリウム、炭酸カリウム等）およびパラジウム触媒（[ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセン]ジクロロパラジウム（II）のジクロロメタン錯体、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム等）の存在下にて反応（より具体的には、例えば、J. Org. Chem., 1995, 60, 7508-7510. に記載の方法に準じて行なう）することにより、製造することが出来る。反応終了後の反応液は、水に注加した後、有機溶媒抽出、濃縮等の後処理を行い、目的化合物を得ることができる。該化合物は再結晶等により精製することができる。

(2) 一般式[1-5]で表わされるオキシム化合物の製造法

一般式[1-5]で表わされるオキシム化合物は、一般式[1-4]で示されるホ

ウ酸化合物と一般式 $R^{11}Y$ で表わされるハロゲン化物とを、有機溶媒中（ジメトキシエタン等）、塩基（リン酸カリウム、炭酸カリウム等）およびパラジウム触媒（[ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセン]ジクロロパラジウム（I I）のジクロロメタン錯体、酢酸パラジウム（I I）、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム等を単一、もしくは混合して用いてもよい）の存在下にて反応することにより、製造することができる。反応終了後の反応液は、例えば溶媒を留去した後、残さをクロマトグラフィーに付すか、あるいは有機溶媒抽出、濃縮等の後処理を行い、目的化合物を得ることができる。該化合物は再結晶、クロマトグラフィー等により精製することができる。

- 10 [製造法 E]：一般式 [1] において R^1 が $A^1-C\equiv C-$ 基である、一般式 [1-8] で示される本発明化合物の製造法
- スキーム 4



- 15 [式中、 X^1 は臭素原子または沃素原子を表わし、 A^1 、 U 、 V 及び W は前記と同じ意味を表わす。]

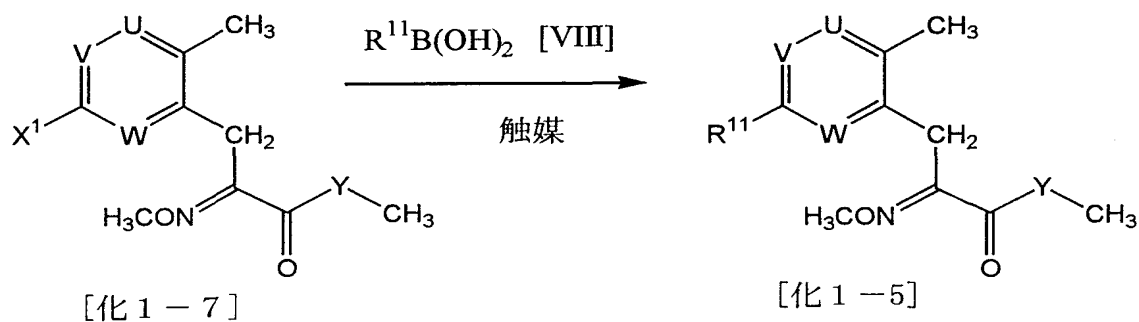
該反応は例えば、非プロトン性極性溶媒（アセトニトリル、 N 、 N -ジメチルホルムアミド等）中、塩基（ジイソプロピルアミン等の 2 級アミン、トリエチルアミン等の 3 級アミン等）および触媒（ビス（トリフェニルホスフィン）ジクロロパラジウム {以下、 $PdCl_2(PPh_3)_2$ と略す} 等のパラジウム触媒、沃化銅（I）およびトリフェニルホスフィンの組合せ等）の存在下にて行なう（より具体的には、国際特許出願 WO 98/03464 号公開明細書の Example 1、Tetrahedron Letters、1975、4467-4470.、Synthesis、1980、627-630.、あるいは J. Org. Chem.、1999、64、2070-2079. に記載の方法に準じて行なう。）ことができる。反応終了後の反応液は有機溶媒抽出、濃縮等の後処理を行い、目的化合物を

得ることができる。該化合物は再結晶、クロマトグラフィー等により精製することができる。

〔製造法F〕：一般式〔1〕において R^1 が置換されていてもよいC6あるいはC10アリール基または置換されていてもよいC1～C9ヘテロアリール基で

5 ある、一般式〔1-5〕で示される本発明化合物の製造法

スキーム5

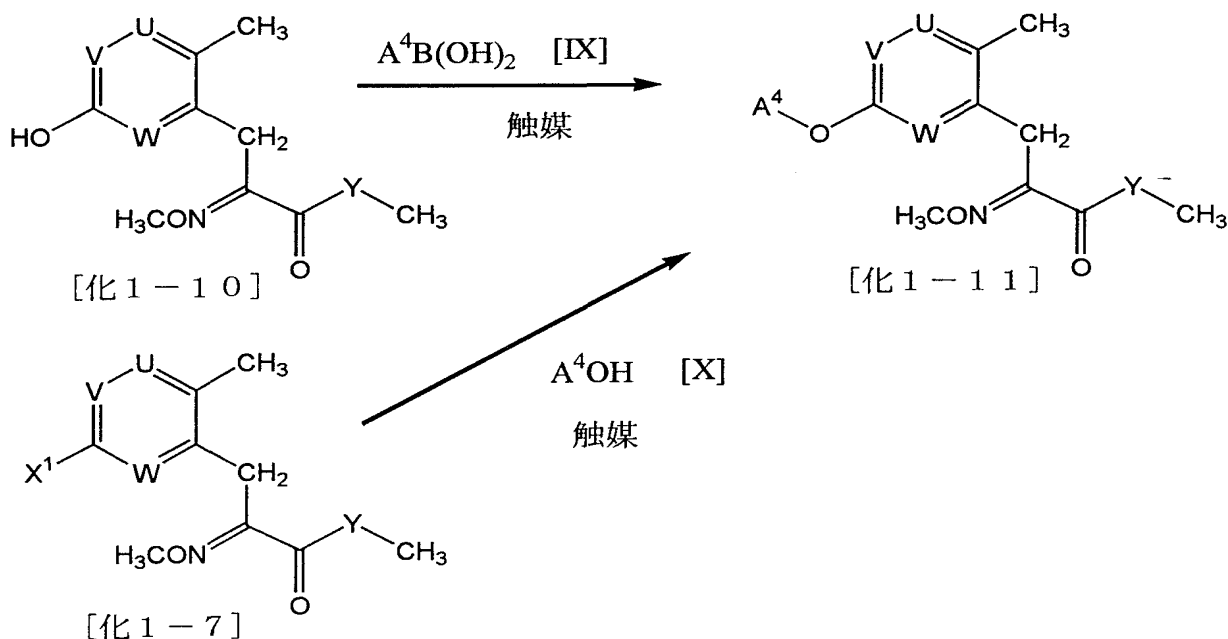


〔式中、 R^{11} 、 X^1 、U、V及びWは前記と同じ意味を表わす。〕

該反応は例えば、水とジメトキシエタンとの混合溶媒中、塩基（重曹等の無機塩基等）および触媒（テトラキス（トリフェニル）ホスフィンパラジウム（以下、 $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ と略す）等）の存在下に行なう（より具体的には、例えば、国際特許出願WO96/35669号公開明細書のBeispiel 2に記載の方法に準じて行なう。）か、または、水溶媒中、臭化テトラ-n-ブチルアンモニウム、塩基（炭酸カリウム等の無機塩基等）および触媒（酢酸パラジウム等）の存在下に行なう（より具体的には、例えば、J. Org. Chem., 1997, 62, 7170-7173に記載の方法に準じて行なう。）ことができる。反応終了後の反応液は有機溶媒抽出、濃縮等の後処理を行い、目的化合物を得ることができる。該化合物は再結晶、クロマトグラフィー等により精製することができる。

20 〔製造法G〕：一般式〔1〕において R^1 が A^4-O- 基である、一般式〔1-11〕で示される本発明化合物の製造法

スキーム 6



[式中、A⁴は置換されていてもよいC 6あるいはC 10アリール基または置換されていてもよいC 1～C 9ヘテロアリール基を表し、U、V、W、X¹およびYは前記と同じ意味を表わす。]

5

(1) 一般式[1-10]で示される化合物より製造する方法

該反応は例えば、有機溶媒（塩化メチレン等）中、塩基（トリエチルアミン等の有機塩基、重曹等の無機塩基等）および触媒（酢酸銅（I I）等）の存在下に行なう（より具体的には、Tetrahedron Letters、1998、39、2937-2940. に記載の方法に準じて行なう。）ことができる。

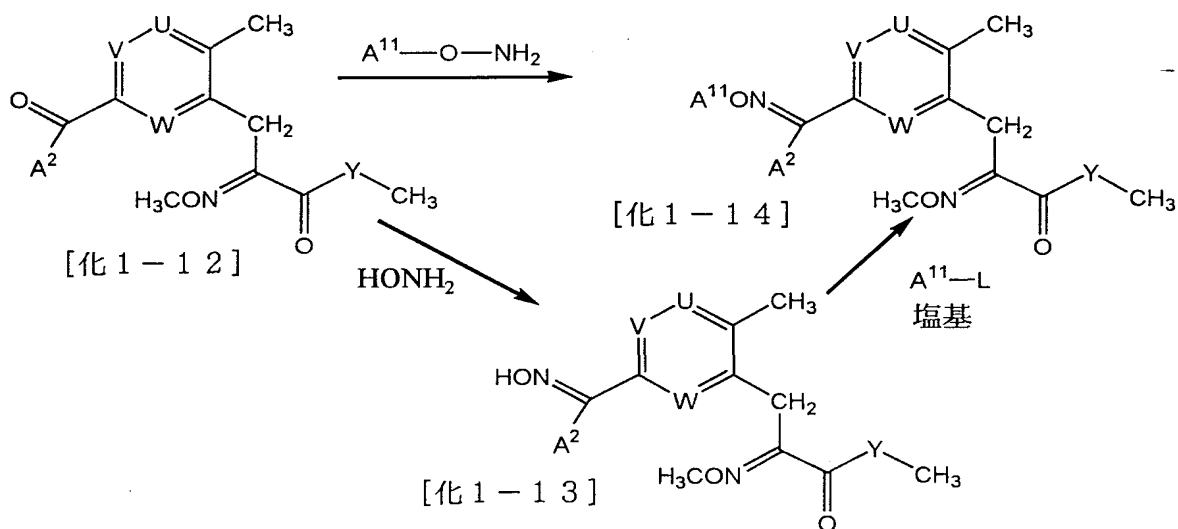
10

(2) 一般式[1-7]で示される化合物より製造する方法

該反応は例えば、有機溶媒（トルエン、酢酸エチル等）中、塩基（トリエチルアミン等の有機塩基、炭酸カリウム、炭酸セシウム等の無機塩基等）および触媒（例えば、よう化銅（I）等）の存在下に行なう（より具体的には、J. Amer. Chem. Soc.、1997、119、10539-10540.、J. Amer. Chem. Soc.、1999、121、3224-3225. もしくはJ. Amer. Chem. Soc.、1999、121、4369-4378. に記載の方法に準じて行なう。）ことができる。反応終了後の反応液は有機溶媒抽出、濃縮等の後処理を行い、目的物を得ることができる。該化合物は再結晶、クロマトグラフィー等により精製することができる。

15

〔製造法H〕：一般式〔1〕において R^1 が $A^1-ON=CA^2$ -基である、一般式〔1-13〕および一般式〔1-14〕で示される本発明化合物の製造法スキーム7

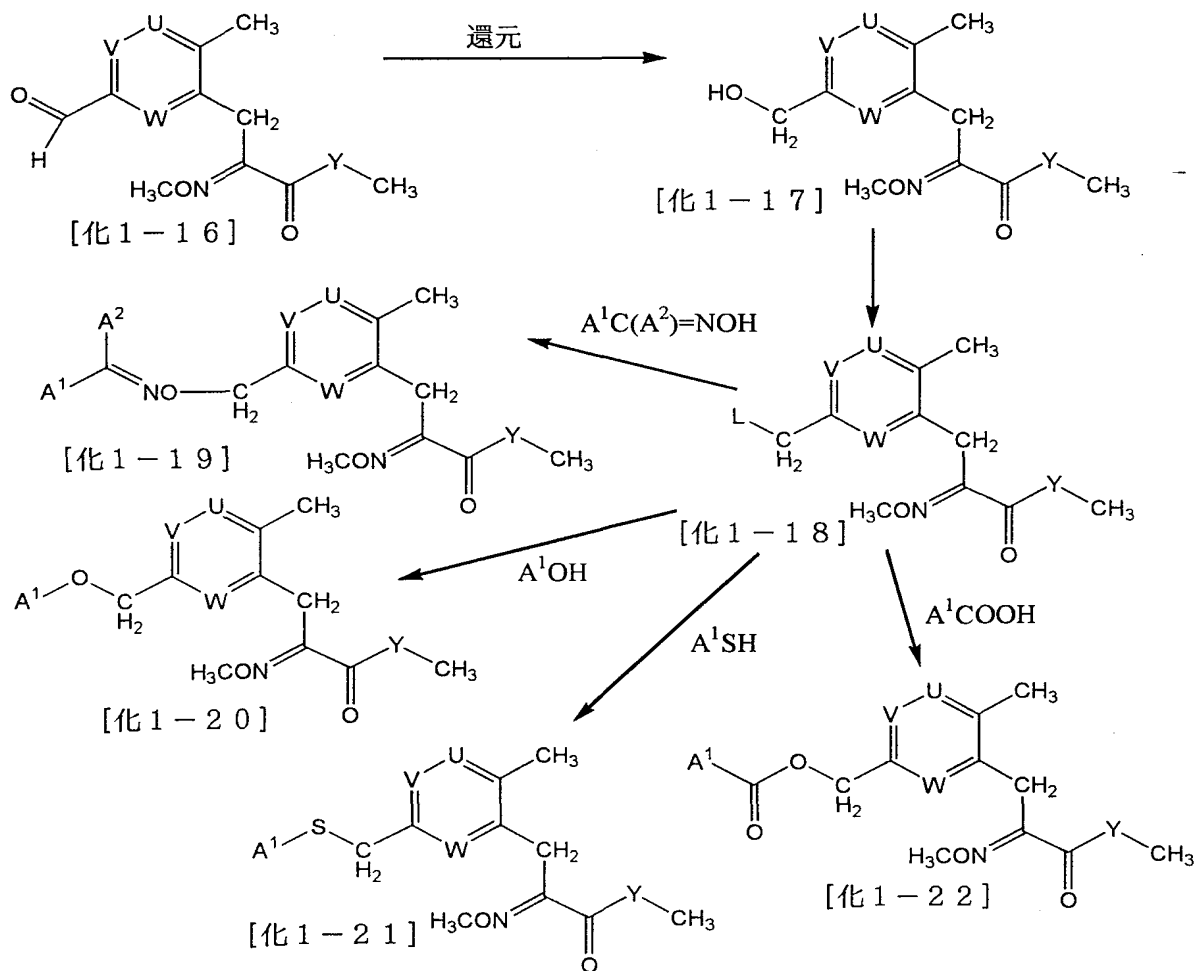


〔式中、 A^{11} は水素原子を除く A^1 と同じ意味を表わし、 L は塩素原子、臭素原子、5 子、沃素原子、 p -トルエンスルホニルオキシ基、メタンスルホニルオキシ基、トリフルオロメタンスルホニルオキシ基等の脱離基を表わし、 A^2 、 U 、 V 、 W 及び Y は前記と同じ意味を表わす。〕

ここで一般式[1-12]で示される化合物のうち、 A^2 がメチル基である場合、一般式[1-7]で示される化合物より、例えば J. Org. Chem., 1992, 57, 1481-1486. に記載される方法に準じて製造することが出来る。

〔製造法〕：

スキーム 8



[式中、A¹、A²、L、U、V、W及びYは前記と同じ意味を表わす。]

本発明化合物を農園芸用殺菌剤の有効成分として用いる場合、他の何らの成分も加えずそのまま用いてもよいが、通常は固体担体、液体担体、界面活性剤、その他の製剤用補助剤と混合して、乳剤、水和剤、顆粒水和剤、エマルジョン製剤、フロアブル剤、粉剤、粒剤等に製剤して用いる。これらの製剤は、有効成分として本発明化合物を、通常、全製剤重量に対して0.1～90%含有する。

かかる製剤化の際に用いられる、固体担体としては、例えばカオリンクレー、アッタパルジャイトクレー、ベントナイト、モンモリロナイト、酸性白土、パイロフィライト、タルク、珪藻土、方解石等の鉱物質、トウモロコシ穂軸粉、クルミ殻粉等の天然有機物、尿素等の合成有機物、炭酸カルシウム、硫酸アンモニウム等の塩類、合成含水酸化珪素等の合成無機物等からなる微粉末あるいは粒状物

等があげられ、液体担体としては、例えばキシレン、アルキルベンゼン、メチルナフタレン等の芳香族炭化水素類、イソプロパノール、エチレングリコール、プロピレングリコール、セロソルブ等のアルコール類、アセトン、シクロヘキサノン、イソホロン等のケトン類、ダイズ油、綿実油等の植物油、石油系脂肪族炭化水素、エステル類、ジメチルスルホキシド、アセトニトリル、水等があげられる。

界面活性剤としては、例えばアルキル硫酸エステル塩、アルキル（アリール）スルホン酸塩、ジアルキルスルホコハク酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリアルエーテルリン酸エステル塩、リグニンスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸ホルマリン縮合物等の陰イオン界面活性剤、ポリオキシエチレンアルキルアリアルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルポリオキシプロピレンブロックコポリマー、ソルビタン脂肪酸エステル等の非イオン界面活性剤等があげられる。

製剤用補助剤としては、例えばポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン等の水溶性高分子、アラビアガム、アルギン酸およびその塩、CMC（カルボキシメチルセルロース）、ゼンサンガム、等の多糖類、アルミニウムマグネシウムシリケート、アルミナゾル等の無機物、防腐剤、着色剤、PAP（酸性リン酸イソプロピル）、BHT等の安定化剤等があげられる。

本発明化合物の施用方法としては、具体的には茎葉散布、土壌処理、種子消毒等があげられ、さらに、通常、当業者が利用するどのような施用方法にても用いることができる。

本発明化合物を農園芸用殺菌剤の有効成分として用いる場合、その有効成分の施用量は、対象植物（作物等）の種類、対象病害の種類、病害の発生程度、製剤形態、施用方法、施用時期、気象条件等によって変化し得るが、1アールあたり通常0.01～50g、好ましくは0.05～10gである。

乳剤、水和剤、フロアブル剤等を水で希釈して施用する場合、その施用濃度は、0.0001～3%、好ましくは0.0005～1%であり、粉剤、粒剤等とはなんら希釈することなくそのまま施用する。

本発明化合物は、畑地、水田、果樹園、茶園、牧草地、芝生地等の農園芸用殺菌剤として用いることができ、他の農園芸用殺菌剤と混用または併用して用いる

- ことにより、殺菌効力の増強をも期待できる。混用または併用して用い得る他の農園芸用殺菌剤としては、たとえば、プロピコナゾール、トリアジメノール、プロクロラズ、ペンコナゾール、テブコナゾール、フルシラゾール、ジニコナゾール、ブロムコナゾール、エポキシコナゾール、ジフェノコナゾール、シプロコナゾール、メトコナゾール、トリフルミゾール、テトラコナゾール、マイクロブタニル、フェンブコナゾール、ヘキサコナゾール、フルキンコナゾール、トリティコナゾール、ビテルタノール、イマザリル及びフルトリアホール等のアゾール系殺菌化合物、フェンプロピモルフ、トリデモルフ及びフェンプロピジン等の環状アミン系殺菌化合物、カルベンダジム、ベノミル、チアベンダゾール、チオファネートメチル等のベンズイミダゾール系殺菌化合物、プロシミドン、シプロディニル、ピリメタニル、ジエトフェンカルブ、チウラム、フルアジナム、マンコゼブ、イプロジオン、ビンクロゾリン、クロロタロニル、キャプタン、メパニピリム、フェンピクロニル、フルジオキシニル、ジクロフルアニド、フォルペット、クレソキシムメチル、アゾキシストロビン、N-メチル- α -メトキシイミノ-2-[(2, 5-ジメチルフェノキシ)メチル]フェニルアセトアミド、トリフロキシストロビン、ピコキシストロビン、スピロキサミン、キノキシフェン、フェンヘキサミド、ファモキサドン、フェナミドン (RP-407213)、イプロヴァリカルブ等があげられる。さらに、他の農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、除草剤、植物生長調節剤、肥料と混用または併用することもできる。
- 20 本発明化合物により防除することができる植物病害としては例えば以下のような病害をあげることができる。

イネのいもち病 (*Pyricularia oryzae*)、ごま葉枯病 (*Cochliobolus miyabeanus*)、紋枯病 (*Rhizoctonia solani*)、

- ムギ類のうどんこ病 (*Erysiphe graminis*)、赤かび病 (*Gibberella zeae*)、さび病 (*Puccinia striiformis*, *P. graminis*, *P. recondita*, *P. hordei*)、雪腐病 (*Typhula* sp., *Micronectriella nivalis*)、裸黒穂病 (*Ustilago tritici*, *U. nuda*)、なまぐさ黒穂病 (*Tilletia caries*)、眼紋病 (*Pseudocercospora helminthosporioides*)、雲形病 (*Rhynchosporium secalis*)、葉枯病 (*Septoria tritici*)、ふ枯病 (*Leptosphaeria nodorum*)、

カンキツ類の黒点病 (*Diaporthe citri*)、そうか病 (*Elsinoe fawcetti*)、果実腐敗病 (*Penicillium digitatum*, *P. italicum*)、

リンゴのモニリア病 (*Sclerotinia mali*)、腐らん病 (*Valsa mali*)、うどんこ病 (*Podosphaera leucotricha*)、斑点落葉病 (*Alternaria mali*)、黒星病 (*Venturia inaequalis*)、

ナシの黒星病 (*Venturia nashicola*, *V. pirina*)、黒斑病 (*Alternaria kikuchiana*)、赤星病 (*Gymnosporangium haraeaeum*)、

モモの灰星病 (*Sclerotinia cinerea*)、黒星病 (*Cladosporium carpophilum*)、フォモプシス腐敗病 (*Phomopsis* sp.)、

10 ブドウの黒とう病 (*Elsinoe ampelina*)、晩腐病 (*Glomerella cingulata*)、うどんこ病 (*Uncinula necator*)、さび病 (*Phakopsora ampelopsidis*)、ブラックロット病 (*Guignardia bidwellii*)、べと病 (*Plasmopara viticola*)、

カキの炭そ病 (*Gloeosporium kaki*)、落葉病 (*Cercospora kaki*, *Mycosphaerella nawae*)、

15 ウリ類の炭そ病 (*Colletotrichum lagenarium*)、うどんこ病 (*Sphaerotheca fuliginea*)、つる枯病 (*Mycosphaerella melonis*)、つる割病 (*Fusarium oxysporum*)、べと病 (*Pseudoperonospora cubensis*)、疫病 (*Phytophthora* sp.)、苗立枯病 (*Pythium* sp.)、

20 トマトの輪紋病 (*Alternaria solani*)、葉かび病 (*Cladosporium fulvum*)、疫病 (*Phytophthora infestans*)、

ナスの褐紋病 (*Phomopsis vexans*)、うどんこ病 (*Erysiphe cichoracearum*)、アブラナ科野菜の黒斑病 (*Alternaria japonica*)、白斑病 (*Cercospora brassicae*)、

25 ネギのさび病 (*Puccinia allii*)、ダイズの紫斑病 (*Cercospora kikuchii*)、黒とう病 (*Elsinoe glycines*)、黒点病 (*Diaporthe phaseolorum* var. *sojae*)、インゲンの炭そ病 (*Colletotrichum lindemthianum*)、ラッカセイの黒渋病 (*Cercospora personata*)、褐斑病 (*Cercospora arachidicola*)、エンドウのうどんこ病 (*Erysiphe pisi*)、ジャガイモの夏疫病 (*Alternaria solani*)、疫病 (*Phytophthora infestans*)、イチゴのうどんこ病 (*Sphaerotheca humuli*)、チ

ヤの網もち病 (*Exobasidium reticulatum*)、白星病 (*Elsinoe leucospila*)、タバコの赤星病 (*Alternaria longipes*)、うどんこ病 (*Erysiphe cichoracearum*)、炭そ病 (*Colletotrichum tabacum*)、べと病 (*Peronospora tabacina*)、疫病 (*Phytophthora nicotianae*)、テンサイの褐斑病 (*Cercospora beticola*)、バラの黒星病 (*Diplocarpon rosae*)、うどんこ病 (*Sphaerotheca pannosa*)、キクの褐斑病 (*Septoria chrysanthemi-indici*)、白さび病 (*Puccinia horiana*)、種々の作物の灰色かび病 (*Botrytis cinerea*)、菌核病 (*Sclerotinia sclerotiorum*) 等。

本発明化合物を殺虫・殺ダニ剤の有効成分として用いる場合は、他の何らの成分も加えず、そのまま使用してもよいが、通常は、固体担体、液体担体、ガス状担体、餌等と混合し、必要であれば界面活性剤、その他の製剤用補助剤を添加して、油剤、乳剤、水和剤、フロアブル剤、マイクロカプセル剤、粒剤、粉剤、エアゾール、煙霧剤（フォギング等）、毒餌等に製剤して使用する。これらの製剤は、有効成分として本発明化合物を、通常、全製剤重量に対して 0.01%～95% 含有する。

かかる製剤化の際に用いられる、固体担体としては、たとえば粘土類（カオリンクレー、珪藻土、合成含水酸化珪素、ベントナイト、フバサミクレー、酸性白土等）、タルク類、セラミック、その他の無機鉱物（セリサイト、石英、硫黄、活性炭、炭酸カルシウム、水和シリカ等）、化学肥料（硫安、燐安、硝安、尿素、塩安等）等の微粉末あるいは粒状物等があげられ、液体担体としては、たとえば水、アルコール類（メタノール、エタノール等）、ケトン類（アセトン、メチルエチルケトン等）、芳香族炭化水素類（ベンゼン、トルエン、キシレン、エチルベンゼン、メチルナフタレン等）、脂肪族炭化水素類（*n*-ヘキサン、シクロヘキサン、灯油、軽油等）、エステル類（酢酸エチル、酢酸ブチル等）、ニトリル類（アセトニトリル、イソブチロニトリル等）、エーテル類（ジイソプロピルエーテル、ジオキサン等）、酸アミド類（*N*, *N*-ジメチルホルムアミド、*N*, *N*-ジメチルアセトアミド等）、ハロゲン化炭化水素類（ジクロロメタン、トリクロロエタン、四塩化炭素等）、ジメチルスルホキシド、大豆油、綿実油等の植物油等があげられ、ガス状担体、すなわち噴射剤としては、たとえばフロン

ガス、ブタンガス、L P G（液化石油ガス）、ジメチルエーテル、炭酸ガス等があげられる。

界面活性剤としては、たとえばアルキル硫酸エステル塩、アルキルスルホン酸塩、アルキルアリアルスルホン酸塩、アルキルアリアルエーテル類およびそのポリオキシエチレン化物、ポリエチレングリコールエーテル類、多価アルコールエステル類、糖アルコール誘導体等があげられる。

固着剤や分散剤等の製剤用補助剤としては、たとえばカゼイン、ゼラチン、多糖類（でんぷん粉、アラビアガム、セルロース誘導体、アルギン酸等）、リグニン誘導体、ベントナイト、糖類、合成水溶性高分子（ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、ポリアクリル酸類等）等があげられ、安定剤としては、たとえばP A P（酸性リン酸イソプロピル）、B H T（2，6-ジ-tert-ブチル-4-メチルフェノール）、B H A（2-tert-ブチル-4-メトキシフェノールと3-tert-ブチル-4-メトキシフェノールとの混合物）、植物油、鉱物油、界面活性剤、脂肪酸またはそのエステル等があげられる。

毒餌の基材としては、たとえば穀物粉、植物油、糖、結晶セルロース等の餌成分、ジブチルヒドロキシトルエン、ノルジヒドログアイアレチン酸等の酸化防止剤、デヒドロ酢酸等の保存料、トウガラシ末等の誤食防止剤、チーズ香料、タマネギ香料等の誘引性香料等があげられる。

本発明化合物を殺虫・殺ダニ剤として用いる場合、その有効成分の施用量は、通常、10アールあたり、0.1g～100gであり、乳剤、水和剤、フロアブル剤、マイクロカプセル剤等を水で希釈して用いる場合は、その施用濃度は通常、0.1ppm～10000ppmであり、粒剤、粉剤等は何ら希釈することなく製剤のままで施用する。また、防疫用殺虫・殺ダニ剤として用いる場合には、乳剤、水和剤、フロアブル剤、マイクロカプセル剤等は、通常、水で0.1ppm～5000ppmに希釈して施用し、油剤、エアゾール、煙霧剤、毒餌等についてはそのまま施用する。

これらの施用量、施用濃度は、いずれも製剤の種類、施用時期、施用場所、施用方法、害虫の種類、被害程度等の状況によって変化し得るが、上記の範囲にかかわることなく増減させることができる。

本発明化合物は、他の殺虫剤、殺線虫剤、殺ダニ剤と混用または併用すること
もできる。かかる殺虫剤及び／または殺ダニ剤及び／または殺線虫剤としては、
例えばフェニトロチオン、フェンチオン、ダイアジノン、クロルピリホス、アセ
フェート、メチダチオン、ジスルホトン、DDVP、スルプロホス、シアノホ
5 ス、プロフェノホス、ジメトエート、フェントエート、マラチオン、トリクロル
ホン、アジンホスメチル、モノクロトホス、エチオン、ホスチアゼート等の有機
リン系化合物、BPMC、ベンフラカルブ、プロポキスル、カルボスルファン、
カルバリル、メソミル、エチオフェンカルブ、アルジカルブ、オキサミル、フェ
ノチオカルブ、チオジカルブ等のカーバメート系化合物、エトフェンブロッ
10 ス、フェンバレレート、エスフェンバレレート、フェンプロパトリン、シペルメ
トリン、アルファシペルメトリン、ゼータシペルメトリン、ペルメトリン、シハ
ロトリン、ラムダシハロトリン、デルタメトリン、トラロメトリン、シクロプロ
スリン、タウフルバリネート、ビフェントリン、アクリナトリン、ハルフェンブ
ロックス、シラフルオフェン等のピレスロイド化合物、アセタミプリド、チアメ
15 トキサム、ニテンピラム等のネオニコチノイド化合物、カルタップ、チオシクラ
ム、ベンスルタップ等のネライストキシシン誘導体、エンドスルファン、gamma-BHC、1, 1-ビス(クロロフェニル)-2, 2, 2-トリクロロエタノ
ール等の塩素化炭化水素化合物、クロルフルアズロン、テフルベンズロン、フル
フェノクスロン、ジフルベンズロン、ヘキサフルムロン、ルフェニユロン等のベ
20 ンゾイルフェニルウレア系化合物、アミトラズ、クロルジメホルム等のホルムア
ミジン誘導体、フェニルピラゾール系化合物、テブフェノジド、ハロフェノジ
ド、メトキシフェノジド等のフェニルヒドラジン誘導体、クロルフェナピル、ブ
ロモプロピレート、テトラジホン、プロパルゲイト、酸化フェンブタスズ、ヘキ
シチアゾクス、クロフェンテジン、ピリダベン、フェンピロキシメート、テブ
25 フェンピラド、トルフェンピラド、フェナザキン、ビフェナゼート、ポリナクチン
コンプレックス〔テトラナクチン、ジナクチン、トリナクチン〕、ミルベメクチ
ン、エバーメクチン、エマメクチン安息香酸塩、アザジラクチン、ピリミジフェ
ン、ピメトロジン、ブプロフェジン、ジアフェンチウロン、シロマジン、エトキ
サゾール、スピノシン誘導体、インドキサカルブ、ロテノン等があげられる。

本発明化合物により防除することができる有害昆虫類や有害ダニ類としては、たとえば下記のものがあげられる。

半翅目害虫：ヒメトビウンカ(*Laodelphax striatellus*)、トビイロウンカ(*Nilaparvata lugens*)、セジロウンカ(*Sogatella furcifera*)等のウンカ類、ツマグ
5 ロヨコバイ(*Nephotettix cincticeps*)、チャノミドリヒメヨコバイ(*Empoasca onukii*)等のヨコバイ類、ワタアブラムシ(*Aphis gossypii*)、モモアカアブラムシ(*Myzus persicae*)等のアブラムシ類、カメムシ類、オンシツコナジラミ(*Trialeurodes vaporariorum*)、タバココナジラミ(*Bemisia tabaci*)、シルバーリーフコナジラミ(*Bemisia argentifolii*)等のコナジラミ類、カイガラムシ類、グンバイ
10 ムシ類、キジラミ類等

鱗翅目害虫：ニカメイガ(*Chilo suppressalis*)、コブノメイガ(*Cnaphalocrocis medinalis*)、ヨーロピアンコーンボーラー(*Ostrinia nubilalis*)、シバツトガ(*Parapediasia teterrella*)等のメイガ類、ハスモンヨトウ(*Spodoptera litura*)、シロイチモジヨトウ(*Spodoptera exigua*)、アワヨトウ(*Pseudaletia separata*)、ヨトウガ(*Mamestra brassicae*)、タマナヤガ(*Agrotis ipsilon*)、トリコブルシア属(*Trichoplusia* spp.)、ヘリオティス属(*Heliothis* spp.)、ヘリコベルパ属(*Helicoverpa* spp.)、エアリアス属(*Earias* spp.)等のヤガ類、モンシロチョウ(*Pieris rapae crucivora*)等のシロチョウ類、リンゴコカクモンハマキ(*Adoxophyes orana fasciata*)、ナシヒメシンクイ(*Grapholita molesta*)、コドリン
15 グモス(*Cydia pomonella*)等のハマキガ類、モモシンクイガ(*Carposina niponensis*)等のシンクイガ類、モモハモグリガ(*Lyonetia clerkella*)等のチビガ類、キンモンホソガ(*Phyllonorycter ringoniella*)等のホソガ類、ミカンハモグリガ(*Phyllocnistis citrella*)等のコハモグリガ類、コナガ(*Plutela xylostella*)等のスガ類、ピンクボールワーム(*Pectinophora gossypiella*)等のキバガ類、ヒトリ
20 ガ類、ヒロズコガ類等

双翅目害虫：イエカ類、ヤブカ類、ハマダラカ類、ユスリカ類、イエバエ類、クロバエ類、ニクバエ類、ハナバエ類、タマバエ類、ハモグリバエ類、ミバエ類、ショウジョウバエ類、チョウバエ類、アブ類、ブユ類、サシバエ類等

鞘翅目害虫：ハムシ類、コガネムシ類、ゾウムシ類、オトシブミ類、テントウ

ムシ類、カミキリムシ類、ゴミムシダマシ類等

アザミウマ目害虫：ミナミキイロアザミウマ (*Thrips palmi*) 等のスリップス
属、ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*) 等のフランクリニエ
ラ属、チャノキイロアザミウマ (*Sciltothrips dorsalis*) 等のシルトスリップス

5 属等のアザミウマ類、クダアザミウマ類等

膜翅目害虫：ハバチ類、アリ類、スズメバチ類等

網翅目害虫：ゴキブリ類、チャバネゴキブリ類等

直翅目害虫：バッタ類、ケラ類等

隠翅目害虫：ヒトノミ等

10 シラミ目害虫：ヒトジラミ等

シロアリ目害虫：シロアリ類等

ダニ目：ナミハダニ (*Tetranychus urticae*)、カンザワハダニ (*Tetranychus kanzawai*)、ミカンハダニ (*Panonychus citri*)、リンゴハダニ (*Panonychus urmi*) などのハダニ類、ホコリダニ類、サビダニ類、オウシマダニなどの動物

15 寄生性のマダニ類、室内塵性ダニ類等

さらに既存の殺虫・殺ダニ剤に対し、抵抗性の発達した害虫にも有効である。

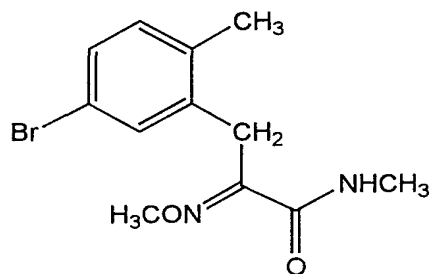
実施例

以下、本発明を製造例、製剤例及び試験例等によりさらに詳しく説明するが、
本発明は、これらの例のみに限定されるものではない。

20 まず、本発明化合物の製造例および本発明化合物の製造中間体の製造例を、製造例および参考製造例にて示す。尚、本発明化合物の番号は後記表 1～表 22 に記載の化合物番号である。

製造例 1：式 [2] で示される本発明化合物 40 の製造法

式 [2]



N-メチルー2-アセチルアミド-3-(5-ブロモ-2-メチルフェニル)-
 -アクリルアミド(後記式[6]で示される化合物) 1.86g (6.0mmol)
 1) およびメトキシアミン塩酸塩 551mg (6.6mmol) をメタノール
 (28ml) と水 (1ml) の混合溶媒に溶解した溶液に、濃塩酸 (0.7m
 5 1) を加えた。還流温度で22時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去し、残さをク
 ロロホルムで希釈した。水洗、乾燥(硫酸マグネシウム)後、濃縮し、残さをシ
 リカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン:酢酸エチル=4:1、つい
 で3:1で溶出)に付し、N-メチルー3-(5-ブロモ-2-メチルフェニ
 ル)-2-(メトキシイミノ)プロパンアミド(本発明化合物40) 1.32g
 10 (4.42mmol)を得た。

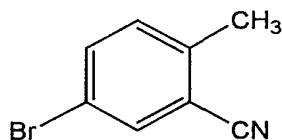
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm): 6.95-7.30 (3H, m)、6.76 (1H, br)、3.98
 (3H, s)、3.87 (2H, s)、2.90 (3H, d, $J=5\text{Hz}$)、
 2.33 (3H, s)

15 参考製造例1

(1): 式[3]で示される化合物の製造法

式[3]



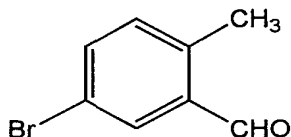
Na-X型ゼオライト乾燥粉末(東ソー株式会社製のゼオラムtypeF-9; 100
 メッシュ以下) 100gを攪拌した中に、2-メチルベンズニトリル 17.6g
 20 (150mmol)を滴下した。そこへ、45~50℃で臭素 32.0g (20
 0mmol)を滴下し、80℃で2時間攪拌した。メタノール(200ml)を
 加えて、室温で1時間攪拌した後、濾過した。さらにろ残のゼオライト粉末をメ
 タノール(100ml×4回)で洗浄した。ろ液および洗浄液を合せて濃縮
 し、残さを酢酸エチルで希釈し、2回水洗し、乾燥した後、濃縮した。残さをn
 25 -ヘキサンで洗浄し、5-ブロモ-2-メチルベンズニトリル 14.1g (7
 1.9mmol)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm) : 7.72 (1H, d, $J=2\text{ Hz}$), 7.59 (1H, dd, $J=2, 6\text{ Hz}$), 7.20 (1H, d, $J=6\text{ Hz}$)

(2) : 式 [4] で示される化合物の製造法

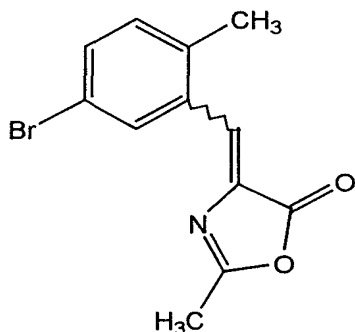
5 式 [4]



窒素雰囲気下、5-ブロモ-2-メチルベンズニトリル 5.58 g (30 mmol) のトルエン 30 ml 溶液に、 -30°C において水素化ジイソブチルアルミニウムのトルエン溶液 (1.5 M 溶液) 24 ml (36 mmol) を滴下した。徐々に 0°C まで昇温しながら 5 時間攪拌した。氷浴中において希塩酸を加えて液性を中性にした後、メタノールとセライトを加えて 1 時間攪拌してからろ過して不溶物を除去した。ろ液を濃縮した後、残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1 で溶出) に付し、5-ブロモ-2-メチルベンズアルデヒド 5.80 g を得た。

(3) : 式 [5] で示される化合物の製造法

15 式 [5]



5-ブロモ-2-メチルベンズアルデヒド 5.80 g、アセチルグリシン 3.51 g (30.0 mmol) および酢酸ナトリウム 2.46 g (30.0 mmol) を無水酢酸 30 ml に加えた後、 170°C において 7 時間攪拌した。続いて減圧下に無水酢酸を留去した後、残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (1 回目 ; n-ヘキサン : 酢酸エチル = 4 : 1、2 回目 ; n-ヘキサン : 酢酸エ

チル＝10：1、ついで4：1で溶出）に付し、式〔5〕で示される化合物3.

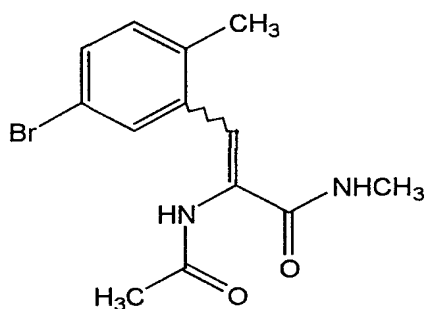
25 g (11.6 mmol) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm) : 8.72 (1H, d, $J=2\text{ Hz}$), 7.42 (1H, dd, $J=$
5 2、8 Hz), 7.30 (1H, s), 7.10 (1H, d, $J=8\text{ Hz}$)、
2.42 (3H, s)、2.42 (3H, s)

(4) : 式〔6〕で示される化合物の製造法

式〔6〕



室温において、式〔5〕で示される化合物2.60 g (9.3 mmol) のト
10 ルエン10 ml 溶液に、メチルアミンのメタノール溶液 (40%) 0.50 ml
を加えた後、室温において1時間攪拌した。析出した結晶をろ取し、N-メチル
-2-アセチルアミド-3-(5-ブロモ-2-メチルフェニル)-アクリルア
ミド1.86 g (6.0 mmol) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$)

15 δ (ppm) : 9.29 (1H, br)、8.00 (1H, d, $J=4\text{ Hz}$), 7.
45 (1H, d, $J=2\text{ Hz}$), 7.37 (1H, dd, $J=2、4\text{ Hz}$),
7.18 (1H, d, $J=8\text{ Hz}$)、7.05 (1H, s)、2.66 (3H、
d、 $J=5\text{ Hz}$)、2.19 (3H, s)、1.88 (3H, s)

製造例2

20 N-メチル-3-(5-ブロモ-2-メチルフェニル)-2-メトキシイミノ
プロピオンアミド192 mg (0.64 mmol)、4-クロロフェニルボロン
酸113 mg (0.72 mmol)、臭化テトラ-n-ブチルアンモニウム20
6 mg (0.64 mmol)、炭酸カリウム221 mg (1.6 mmol) およ

び酢酸パラジウム 11.4 mg (0.064 mmol) を水 (0.64 ml) に加えた後、70℃にて3時間攪拌した。室温まで冷却後、クロロホルムで希釈、水洗、乾燥 (硫酸マグネシウム) した後、減圧下において濃縮した。残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル=2：1で溶出) に付し、N-メチル-3-[5-(4-クロロフェニル)-2-メチルフェニル]-2-(メトキシイミノ)プロパンアミド (本発明化合物7) 174 mg (0.53 mmol) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃, TMS)

δ (ppm) : 7.15-7.55 (7H, m)、6.73 (1H, br)、3.98 (3H, s)、3.96 (2H, s)、2.87 (3H, d, J=5 Hz)、2.41 (3H, s)

製造例3

N-メチル-3-(5-ブロモ-2-メチルフェニル)-2-(メトキシイミノ)プロピオンアミド 239 mg (0.80 mmol)、フェニルボロン酸 110 mg (0.90 mmol)、臭化テトラ-n-ブチルアンモニウム 258 mg (0.80 mmol)、炭酸カリウム 276 mg (2.0 mmol) および酢酸パラジウム 3.6 mg (0.016 mmol) を水 (3 ml) に加えた後、70℃にて3時間攪拌した。室温まで冷却後、クロロホルムで希釈、水洗、乾燥 (硫酸マグネシウム) した後、減圧下において濃縮した。残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル=2：1で溶出) に付し、N-メチル-3-(2-メチル-5-フェニルフェニル)-2-(メトキシイミノ)プロパンアミド (本発明化合物1) 234 mg を得た。

¹H-NMR (CDCl₃, TMS)

δ (ppm) : 7.15-7.55 (8H, m)、6.73 (1H, br)、3.98 (3H, s)、3.96 (2H, s)、2.87 (3H, d, J=5 Hz)、2.41 (3H, s)

製造例4

N-メチル-3-(5-ブロモ-2-メチルフェニル)-2-(メトキシイミノ)プロパンアミド 239 mg (0.80 mmol)、4-メチルフェニルボロ

ン酸 122 mg (0.90 mmol)、臭化テトラ-*n*-ブチルアンモニウム 258 mg (0.80 mmol)、炭酸カリウム 276 mg (2.0 mmol)、酢酸パラジウム 3.6 mg (0.016 mmol) を水 (3 ml) に加えた後、70℃にて5.5時間攪拌した。室温まで冷却後、クロロホルムで希釈、水洗、乾燥 (硫酸マグネシウム) した後、減圧下において濃縮した。残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (*n*-ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1 で溶出) に付し、*N*-メチル-3-[2-メチル-5-(4-メチルフェニル)フェニル]-2-(メトキシイミノプロパン)アミド (本発明化合物4) 213 mg を得た。

¹H-NMR (CDCl₃, TMS)

δ (ppm) : 6.90-7.50 (7H, m)、6.74 (1H, br)、3.97 (3H, s)、3.96 (2H, s)、2.87 (3H, d, J = 5 Hz)、2.41 (3H, s)、2.38 (3H, s)

製造例5

N-メチル-3-(5-ブロモ-2-メチルフェニル)-2-(メトキシイミノ)プロパンアミド 150 mg (0.50 mmol)、3,4-ジクロロフェニルボロン酸 114 mg (0.60 mmol)、臭化テトラ-*n*-ブチルアンモニウム 161 mg (0.50 mmol)、炭酸カリウム 173 mg (1.3 mmol)、酢酸パラジウム 11.2 mg (0.050 mmol) を水 (0.6 ml) に加えた後、70℃にて4時間攪拌した。室温まで冷却後、クロロホルムで希釈、水洗、乾燥 (硫酸マグネシウム) した後、減圧下において濃縮した。残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (*n*-ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1 で溶出) に付し、*N*-メチル-3-[5-(3,4-ジクロロフェニル)-2-メチルフェニル]-2-(メトキシイミノ)プロパンアミド (本発明化合物14) 162 mg (0.44 mmol) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃, TMS)

δ (ppm) : 7.15-7.60 (6H, m)、6.77 (1H, br)、3.98 (3H, s)、3.96 (2H, s)、2.88 (3H, d, J = 5 Hz)、2.42 (3H, s)

製造例6

N-メチル-3-(5-ブロモ-2-メチルフェニル)-2-(メトキシイミノ)プロパンアミド 150 mg (0.50 mmol)、4-tert-ブチルフェニルボロン酸 142 mg (0.80 mmol)、臭化テトラ-n-ブチルアンモニウム 161 mg (0.50 mmol)、炭酸カリウム 173 mg (1.3 mmol)、酢酸パラジウム 11.2 mg (0.050 mmol) を水 (0.60 ml) に加えた後、75℃にて3時間攪拌した。室温まで冷却後、クロロホルムで希釈、水洗、乾燥(硫酸マグネシウム)した後、減圧下において濃縮した。残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン:酢酸エチル=2:1で溶出)に付し、N-メチル-3-[5-(4-tert-ブチルフェニル)-2-メチルフェニル]-2-(メトキシイミノ)プロパンアミド(本発明化合物 15) 152 mg (0.43 mmol) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm): 7.15–7.52 (7H, m)、6.73 (1H, br)、3.98 (3H, s)、3.96 (2H, s)、2.87 (3H, d, $J=5\text{ Hz}$)、2.41 (3H, s)、1.35 (6H, s)

製造例 7

N-メチル-3-(5-ブロモ-2-メチルフェニル)-2-(メトキシイミノ)プロパンアミド 120 mg (0.40 mmol)、2-メチルフェニルボロン酸 68 mg (0.50 mmol)、臭化テトラ-n-ブチルアンモニウム 129 mg (0.40 mmol)、炭酸カリウム 138 mg (1.0 mmol)、酢酸パラジウム 9.0 mg (0.040 mmol) を水 (0.40 ml) に加えた後、75℃にて5時間攪拌した。室温まで冷却後、クロロホルムで希釈、水洗、乾燥(硫酸マグネシウム)した後、減圧下において濃縮した。残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン:酢酸エチル=2:1で溶出)に付し、N-メチル-3-[2-メチル-5-(2-メチルフェニル)フェニル]-2-(メトキシイミノ)プロパンアミド(本発明化合物 2) 113 mg (0.36 mmol) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm): 6.85–7.26 (7H, m)、6.70 (1H, br)、3.94

(3 H, s)、3.94 (2 H, s)、2.85 (3 H, d, J = 5 Hz)、
2.41 (3 H, s)、2.24 (3 H, s)

製造例 8

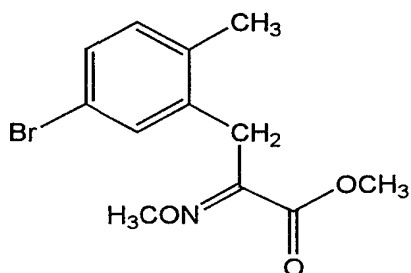
N-メチル-3-(2-メチル-5-ブロモフェニル)-2-メトキシイミノ
5 プロピオンアミド 100 mg (0.33 mmol)、3,4-ジメチルフェニル
ボロン酸 60 mg (0.40 mmol)、臭化テトラ-n-ブチルアンモニウム
110 mg (0.34 mmol)、炭酸カリウム 114 mg (0.83 mmol)、
酢酸パラジウム 7.4 mg (0.033 mmol) を水 (0.40 ml)
に加えた後、75℃にて7時間攪拌した。室温まで冷却後、クロロホルムで希
10 釈、水洗、乾燥(硫酸マグネシウム)した後、減圧下において濃縮した。残さを
シリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン:酢酸エチル=2:1で溶
出)に付し、N-メチル-3-[5-(3,4-ジメチルフェニル)-2-メチ
ルフェニル]-2-(メトキシイミノ)プロパンアミド(本発明化合物12) 7
2 mg (0.22 mmol)を得た。

15 ¹H-NMR (CDCl₃, TMS)

δ (ppm): 7.13-7.35 (6 H, m)、6.73 (1 H, br)、3.96
(3 H, s)、3.94 (2 H, s)、2.86 (3 H, d, J = 5 Hz)、
2.41 (3 H, s)、2.31 (3 H, s)、2.29 (3 H, s)

製造例 9: 式 [7] で示される本発明化合物 1040 の製造法

20 式 [7]



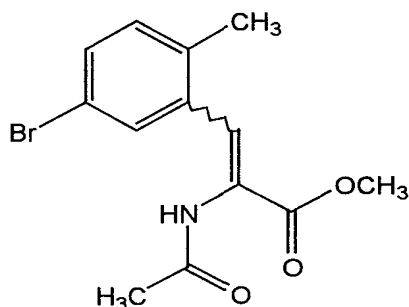
メチル 2-アセチルアミド-3-(5-ブロモ-2-メチルフェニル) アク
リレート (後記式 [8] で示される化合物) 91 g (292 mmol) およびメ
トキシアミン塩酸塩 26.1 g (312 mmol) をメタノール (1600 m
l) に溶解した溶液に、濃塩酸 (26 ml) を加えた。還流温度で44時間攪拌

した後、減圧下溶媒を留去し、残さをクロロホルムで希釈した。水洗、乾燥（硫酸マグネシウム）後、濃縮し、残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルムで溶出）に付し、メチル 3-（5-ブロモ-2-メチルフェニル）-2-（メトキシイミノ）プロパノエート（本発明化合物1040）76.2 g（254 mmol）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm) : 7.22 (1H, d)、7.14 (1H, s)、7.00 (1H, d、)、4.08 (3H, s)、3.85 (2H, s)、3.83 (3H, s)、2.29 (3H, s)

10 参考製造例2：式[8]で示される化合物の製造法
式[8]



室温において、式[5]で示される化合物90.0 g（321 mmol）のメタノール（500 ml）溶液に48%水酸化ナトリウム水溶液1.4 mlを加えた。メタノール（100 ml）を追加した後、室温で2.5時間攪拌した。減圧濃縮によりメタノールを留去した後、イソプロピルエーテルを加え、生じた結晶をろ過後、乾燥して91.1 g（292 mmol）のメチル 2-アセチルアミノ-3-（5-ブロモ-2-メチルフェニル）アクリレートを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3)

δ (ppm) : 7.44 (1H, s), 7.22-7.38 (2H, m), 7.18 (1H, br)、7.08 (1H, d)、3.85 (3H, s)、2.27 (3H, s) 2.02 (3H, s)

製造例10

製造例2の方法に準じて、N-メチル-3-（5-ブロモ-2-メチルフェニル）

ル) - 2 - (メトキシイミノ) プロパンアミドと 2-クロロフェニルホウ酸とを反応させることにより、N-メチル-3-[5-(2-クロロフェニル)-2-メチルフェニル]-2-(メトキシイミノ) プロパンアミド (本発明化合物 5) を得た。

5 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm) : 7. 13 - 7. 35 (6H, m)、6. 73 (1H, br)、3. 96 (3H, s)、3. 94 (2H, s)、2. 86 (3H, d, $J=5\text{Hz}$)、2. 41 (3H, s)、2. 31 (3H, s)、2. 29 (3H, s)

製造例 1 1

- 10 製造例 2 の方法に準じて、N-メチル-3-(5-ブロモ-2-メチルフェニル)-2-(メトキシイミノ) プロパンアミドと 3-フルオロフェニルホウ酸とを反応させることにより、N-メチル-3-[5-(3-フルオロフェニル)-2-メチルフェニル]-2-(メトキシイミノ) プロパンアミド (本発明化合物 19) を得た。

15 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm) : 7. 15 - 7. 48 (6H, m)、6. 95 - 7. 10 (1H, m)、6. 77 (1H, br)、3. 99 (3H, s)、3. 96 (2H, s)、2. 87 (3H, d, $J=5\text{Hz}$)、2. 42 (3H, s)

製造例 1 2

- 20 製造例 2 の方法に準じて、N-メチル-3-(5-ブロモ-2-メチルフェニル)-2-(メトキシイミノ) プロパンアミドと 4-フルオロフェニルホウ酸とを反応させることにより、N-メチル-3-[5-(4-フルオロフェニル)-2-メチルフェニル]-2-(メトキシイミノ) プロパンアミド (本発明化合物 20) を得た。

25 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm) : 7. 42 - 7. 52 (2H, m)、7. 03 - 7. 30 (5H, m)、6. 74 (1H, br)、3. 98 (3H, s)、3. 95 (2H, s)、2. 87 (3H, d, $J=5\text{Hz}$)、2. 41 (3H, s)

製造例 1 3

製造例 2 の方法に準じて、N-メチル-3-(5-ブロモ-2-メチルフェニル)-2-(メトキシイミノ)プロパンアミドと4-トリフルオロフェニルホウ酸とを反応させることにより、N-メチル-3-[2-メチル-5-(4-トリフルオロメチルフェニル)フェニル]-2-(メトキシイミノ)プロパンアミド

5 (本発明化合物 25) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm) : 7.58-7.72 (4H, m)、7.28-7.38 (2H, m)、
7.22 (1H, d, $J=8\text{ Hz}$)、6.75 (1H, br)、3.98 (3
H, s)、3.96 (2H, s)、2.87 (3H, d, $J=5\text{ Hz}$)、2.4
10 3 (3H, s)

製造例 14

メチル 3-(2-メチル-5-ブロモフェニル)-2-メトキシイミノプロ
パノエート 1.92 g (4.0 mmol)、フェニルボロン酸 585 mg (4.
8 mmol)、臭化テトラ-*n*-ブチルアンモニウム 1.32 g (4.1 mmol)
15 1)、炭酸カリウム 1.38 g (10 mmol)、酢酸パラジウム 180 mg
(0.80 mmol) を水 (4.0 ml) に加えた後、75℃にて9時間攪拌し
た。室温まで冷却後、クロロホルムで抽出、水洗、乾燥 (硫酸マグネシウム) し
た後、減圧下において濃縮した。残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー
(*n*-ヘキサン：酢酸エチル=10：1で溶出) に付し、メチル 3-(2-メ
20 チル-5-フェニル)フェニル-2-メトキシイミノプロピオネート (本発明化
合物 1001) 594 mg (2.0 mmol) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm) : 7.17-7.63 (8H, m)、4.09 (3H, s)、3.96
(2H, s)、3.82 (3H, s)、2.38 (3H, s)

25 製造例 15

メチル 3-(5-ブロモ-2-メチルフェニル)-2-(メトキシイミノ)
プロパノエート 540 mg (1.80 mmol)、4-クロロフェニルボロン酸
338 mg (2.16 mmol)、臭化テトラ-*n*-ブチルアンモニウム 580
mg (1.80 mmol)、炭酸カリウム 622 mg (4.50 mmol) およ

び酢酸パラジウム 40.4 mg (0.18 mmol) を水 (2.0 ml) に加えた後、80℃にて6.5時間攪拌した。室温まで冷却後、クロロホルムで抽出、水洗、乾燥 (硫酸マグネシウム) した後、減圧下において濃縮した。残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル=4：1で溶出) に付し、メチル 3- {5- (4-クロロフェニル) -2-メチルフェニル} -2-メトキシイミノプロパノエート (本発明化合物 1007) 198 mg (0.53 mmol) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃, TMS)

δ (ppm) : 7.12-7.77 (7H, m)、4.09 (3H, s)、3.96 (2H, s)、3.82 (3H, s)、2.38 (3H, s)

製造例 16

メチル 3- {5- (4,4,5,5-テトラメチルー1,3,2-ジオキソボロラニル) -2-メチル} フェニルー2- (メトキシイミノ) プロパノエート 400 mg (1.15 mmol)、2-ブロモピリミジン 237 mg (1.49 mmol)、リン酸3カリウム水和物 1.2 g (5.65 mmol)、[1,1'-ビス (ジフェニルフォスフィノ) フェロセン] ジクロロパラジウム (II) 塩化メチレン錯体 47 mg および酢酸パラジウム 13 mg (0.06 mmol) をジメトキシエタン (5 ml) に加えた後、83℃にて4時間攪拌した。室温まで冷却後、減圧下において溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル=2：8、次いで酢酸エチルのみで溶出) に付し、メチル 3- {2-メチルー5- (2-ピリミジニル) } フェニルー2- (メトキシイミノ) プロパノエート (本発明化合物 1110) 221 mg (0.74 mmol) を得た。

製造例 17

メチル 3- {2-メチルー5- (2-ピリミジニル) } フェニルー2-メトキシイミノプロパノエート 110 mg (0.367 mmol)、メタノール (1.5 ml) およびテトラヒドロフラン (0.5 ml) の混合物にメチルアミンの40%メタノール溶液 (1.5 ml) を加えて室温にて12時間攪拌した。減圧下において溶媒を留去した。残渣をn-ヘキサンで洗浄し、N-メチルー3

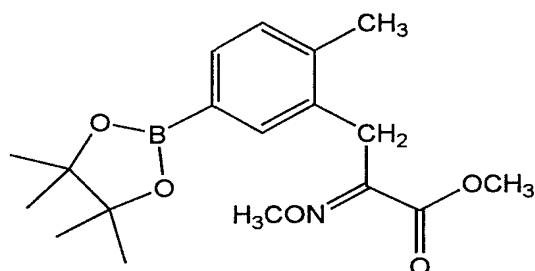
ー {2-メチル-5-(2-ピリミジニル)} フェニル-2-(メトキシイミノ) プロパンアミド (本発明化合物 110) の粗生成物 133mg を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm) : 8.75 (2H, d, $J=6\text{Hz}$)、8.17 (1H, s)、8.1
5 6 (1H, d, $J=8\text{Hz}$)、7.24 (1H, d, $J=8\text{Hz}$)、7.12 (1
H, t, $J=6\text{Hz}$)、6.77 (1H, br)、3.99 (3H, s)、3.
99 (2H, s)、2.87 (3H, d, $J=5\text{Hz}$)、2.44 (3H, s)

参考製造例 3 : 式 [9] で示される化合物の製造法

式 [9]



- 10 メチル 3-(5-ブromo-2-メチル) フェニル-2-(メトキシイミノ)
プロパノエート 443mg (1.47mmol)、ビス (ピナコレート) ジボロ
ン 410mg (1.61mmol)、[1, 1'-ビス (ジフェニルフォスフィ
ノ) フェロセン] ジクロロパラジウム (II) 塩化メチレン錯体 60mg (0.
073mmol) および酢酸カリウム 432mg (4.40mmol) をジメチ
15 ルスルホキシド 11ml に加えた後、80℃にて8時間攪拌した。室温まで冷却
後水を加え、酢酸エチルで抽出、水洗、飽和食塩水洗浄、乾燥 (無水硫酸ナトリ
ウム) した後、減圧下において濃縮した。析出した結晶をn-ヘキサンで洗浄
し、メチル 3-{5-(4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキ
ソボロラニル)-2-メチル} フェニル-2-メトキシイミノプロパノエート 4
20 01mg (0.60mmol) を得た。

mp. = 86.4℃

製造例 18

N-メチル-3-(5-ブromo-2-メチルフェニル)-2-(メトキシイミノ) プロピオンアミド 502mg (1.68mmol)、トリメチルシリルアセ

チレン 2.67 g (2.66 mmol)、酢酸パラジウム 1.9 g (0.085 mmol)、トリフェニルホスフィン 3.7 g (0.14 mmol) および トリエチルアミン 1.5 ml をトルエン 1.5 ml に加えた後、窒素雰囲気下、バス温 50~60℃ にて 6.5 時間攪拌した。トリメチルシリルアセチレン 0.52 g、酢酸パラジウム 1.9 g、トリフェニルホスフィン 3.7 g、トリエチルアミン 0.5 ml および トルエン 0.5 ml を追加して、窒素雰囲気下、バス温 80~90℃ にてさらに 3 時間攪拌した。室温まで冷却後、濾過、濾液を濃縮し、残さをシリカゲル分取薄層クロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル = 2 : 1 で展開) に付し、N-メチル-3-{2-メチル-5-(トリメチルシリル)エチニル}フェニル-2-(メトキシイミノ)プロピオンアミド (本発明化合物 88) 0.19 g (原料化合物 N-メチル-3-(5-ブロモ-2-メチルフェニル)-2-(メトキシイミノ)プロピオンアミドを含む) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm) : 7.20 (1H, dd, $J=8, 2\text{ Hz}$)、7.11 (1H, d, $J=2\text{ Hz}$)、7.05 (1H, d, $J=8\text{ Hz}$)、3.97 (3H, s)、3.85 (2H, s)、2.88 (3H, d, $J=5\text{ Hz}$)、2.36 (3H, s)、0.23 (9H, s)

製造例 19

N-メチル-3-(5-ブロモ-2-メチルフェニル)-2-(メトキシイミノ)プロピオンアミド 5.98 g (2.0 mmol)、tert-ブチルアセチレン 1.50 g (18 mmol)、ジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II) [以下 $\text{PdCl}_2(\text{PPh}_3)_2$ と記す] 6.9 g (0.098 mmol)、よう化銅 5.3 g (0.28 mmol)、トリフェニルホスフィン 9.6 g (0.37 mmol) および トリエチルアミン 1.4 ml をアセトニトリル 8 ml に加えた後、窒素雰囲気下、45℃ にて 9 時間攪拌した。室温まで冷却後 tert-ブチルメチルエーテルで希釈、水洗、乾燥 (硫酸マグネシウム) した後、減圧下において濃縮した。残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル = 9 : 1 で溶出) に付し、N-メチル-3-{5-(3,3-ジメチル-1-ブチル)-2-メチル}フェニル-2-(メトキシイ

ミノ)プロパンアミド(本発明化合物294) 313mg (1.0mmol)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm): 7.11 (1H, dd, $J=8$, 2Hz)、7.04 (1H, s)、
5 7.01 (1H, d, $J=8$ Hz)、6.72 (1H, br)、3.97 (3H, s)、3.84 (2H, s)、2.87 (3H, d)、2.35 (3H, s)、1.26 (9H, s)

製造例20

N-メチル-3-(5-ブロモ-2-メチルフェニル)-2-(メトキシイミ
10 ノ)プロピオンアミド 596mg (2.0mmol)、フェニルアセチレン 306mg (3.0mmol)、 $\text{PdCl}_2(\text{PPh}_3)_2$ 40mg (0.056mmol)、
よう化銅 15mg (0.079mmol)、トリフェニルホスフィン 60mg (0.23mmol)およびトリエチルアミン 1.5mlをアセトニトリル
6mlに加えた後、窒素雰囲気下、9時間加熱還流した。室温まで冷却後、酢酸
15 エチルで希釈、水洗、乾燥(硫酸マグネシウム)した後、減圧下において濃縮した。残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン:酢酸エチル=5:2、
次いでn-ヘキサン:酢酸エチル=12:5で溶出)に付し、N-メチル-3-{2-メチル-5-(2-フェニル)エチニル}フェニル-2-(メト
キシイミノ)プロパンアミド(本発明化合物286) 290mg (0.91mm
20 ol)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm): 7.42-7.55 (1H, m)、7.20-7.38 (5H, m)、7.18 (1H, s)、7.10 (1H, d, $J=8$ Hz)、6.73
(1H, br)、3.97 (3H, s)、3.89 (2H, s)、2.88 (3H, d, $J=5$ Hz)、2.39 (3H, s)、1.26 (9H, s)
25

製造例21

製造例20の方法に準じて、N-メチル-3-(5-ブロモ-2-メチルフェニル)-2-(メトキシイミノ)プロパンアミドとトリエチルシリルアセチレンとを反応させN-メチル-3-{2-メチル-5-(2-トリエチルシリルエチニ

ル) }フェニル-2-(メトキシイミノ)プロパンアミド(本発明化合物251)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm) : 7.20 (1H, dd, $J=8$, 2Hz)、7.13 (1H, d, $J=2$ Hz)、7.04 (1H, d, $J=8$ Hz)、6.75 (1H, br)、3.97 (3H, s)、3.85 (2H, s)、2.88 (3H, d, $J=5$ Hz)、2.37 (3H, s)、1.03 (9H, t, $J=8$ Hz)、0.68 (6H, q, $J=8$ Hz)

製造例22

10 製造例20の方法に準じて、N-メチル-3-(5-ブロモ-2-メチルフェニル)-2-(メトキシイミノ)プロパンアミドとプロパルギルトリメチルシランとを反応させN-メチル-3-[2-メチル-5-(3-トリメチルシリル-1-エチニル)]フェニル-2-メトキシイミノプロパンアミド(本発明化合物275)を得た。

15 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm) : 7.11 (1H, d, $J=8$ Hz)、7.05 (1H, s)、7.03 (1H, d, $J=8$ Hz)、6.73 (1H, br)、3.97 (3H, s)、3.85 (2H, s)、2.87 (3H, d, $J=5$ Hz)、2.36 (3H, s)、1.77 (2H, s)、0.25 (9H, s)

20 製造例23

製造例20の方法に準じて、N-メチル-3-(5-ブロモ-2-メチルフェニル)-2-(メトキシイミノ)プロパンアミドとプロパルギルベンゼンとを反応させN-メチル-3-[2-メチル-5-(3-フェニル-1-プロピニル)]フェニル-2-メトキシイミノプロパンアミド(本発明化合物291)を得た。

25 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm) : 7.02-7.48 (8H, m)、6.75 (1H, br)、3.97 (3H, s)、3.86 (2H, s)、3.81 (2H, s)、2.88 (3H, d, $J=5$ Hz)、2.37 (3H, s)

製造例24

メチル 3- (5-ブロモ-2-メチルフェニル) -2- (メトキシイミノ) プロパネート 600 mg (2.0 mmol)、トリエチルシリルアセチレン 1.00 g (7.13 mmol)、PdCl₂ (PPh₃)₂ 63 mg (0.090 mmol)、トリフェニルホスフィン 96 mg (0.37 mmol)、よう化銅 30 mg (0.16 mmol) およびトリエチルアミン 1.5 g をアセトニトリル 8 ml に加えた後、窒素雰囲気下、80℃にて4時間攪拌した。室温まで冷却後、tert-ブチルメチルエーテルで希釈、水洗、乾燥 (硫酸マグネシウム) した後、減圧下において濃縮した。残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル=9：1で溶出) に付し、メチル 3- {2-メチル-5- (2-トリエチルシリル) エチニル} フェニル-2- (メトキシイミノ) プロパネート (本発明化合物 1251) 0.19 g を得た。

¹H-NMR (CDCl₃, TMS)

δ (ppm) : 7.23 (1H, d, J=8 Hz)、7.12 (1H, s)、7.07 (1H, d, J=8 Hz)、4.09 (3H, s)、3.87 (2H, s)、3.83 (3H, s)、2.35 (3H, s)、1.04 (9H, t, J=8 Hz)、0.65 (6H, q, J=8 Hz)

製造例 25

製造例 24 の方法に準じて、メチル 3- (5-ブロモ-2-メチルフェニル) -2- (メトキシイミノ) プロパネートと tert-ブチルジメチルシリルアセチレンとを反応させメチル 3- {5- (2-tert-ブチルジメチルシリルエチニル) -2-メチル} フェニル-2- (メトキシイミノ) プロパネート (本発明化合物 1253) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃, TMS)

δ (ppm) : 7.22 (1H, d, J=8 Hz)、7.12 (1H, s)、7.06 (1H, d, J=8 Hz)、4.08 (3H, s)、3.86 (2H, s)、3.83 (3H, s)、2.33 (3H, s)、0.98 (9H, s)、0.17 (6H, s)

製造例 26

製造例 24 の方法に準じて、メチル 3- (5-ブロモ-2-メチルフェニル)

ル) - 2 - (メトキシイミノ) プロパネートとトリメチルシリルアセチレンとを反応させメチル 3 - { 2 - メチル - 5 - (トリメチルシリルエチニル) } フェニル - 2 - (メトキシイミノ) プロパネート (本発明化合物 1088) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

5 δ (ppm) : 7.22 (1H, d, $J=8\text{ Hz}$)、7.12 (1H, s)、7.07 (1H, d, $J=8\text{ Hz}$)、4.08 (3H, s)、3.86 (2H, s)、3.83 (3H, s)、2.34 (3H, s)、0.26 (9H, s)

製造例 27

製造例 24 の方法に準じて、メチル 3 - (5 - ブロモ - 2 - メチルフェニル) - 2 - (メトキシイミノ) プロパネートと *tert*-ブチルアセチレンとを
10 反応メチル 3 - { 5 - (*tert*-ブチルエチニル) - 2 - メチル } フェニル - 2 - (メトキシイミノ) プロパネート (本発明化合物 1294) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

15 δ (ppm) : 7.13 (1H, dd, $J=8, 2\text{ Hz}$)、7.03 (1H, d, $J=8\text{ Hz}$)、7.02 (1H, s)、4.08 (3H, s)、3.85 (2H, s)、3.82 (3H, s)、2.31 (3H, s)、1.30 (9H, s)

製造例 28

N - メチル - 3 - (5 - ブロモ - 2 - メチルフェニル) - 2 - (メトキシイミノ) プロパンアミド 4.37 g (14.6 mmol) を N, N - ジメチルホルム
20 アミド 30 ml に溶かし、これに、酢酸タリウム (I) 4.20 g (16 mmol)、ブチルビニルエーテル 9.34 ml (72.6 mmol)、1,3-ビス (ジフェニルホスフィノ) プロパン 604 mg (3.64 mmol)、酢酸パラジウム 160 mg (0.72 mmol) およびトリエチルアミン 2.44 ml (17.5 mmol) を加えた後、窒素雰囲気下、90℃にて8時間攪拌した。室温
25 まで冷却後、希塩酸水 (濃塩酸 21 ml と水 130 ml を混合して調製) を加えて30分間攪拌した。綿濾過し、クロロホルムで洗浄し、ろ液を分液した。水層をもう一度クロロホルムで抽出したのち、有機層を合せて、水洗、乾燥した後、濃縮した。固体残さに *tert*-ブチルメチルエーテルと *n*-ヘキサンの等量混合物を加えてしばらく室温で攪拌したのち、固体をろ集して、N - メチル - 3 -

(5-アセチル-2-メチルフェニル)-2-(メトキシイミノ)プロパンアミド
(本発明化合物31) 3.97 g (15.2 mmol) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm) : 7.60–7.80 (2H, m)、7.21 (1H, d、 $J=8\text{ Hz}$)、
5 6.78 (1H, br)、3.99 (3H, s)、3.93 (2H, s)、
2.88 (3H, d、 $J=5\text{ Hz}$)、2.53 (3H, s)、2.44
(3H, s)

製造例29

N-メチル-3-(5-アセチル-2-メチルフェニル)-2-(メトキシイ
10 ミノ)プロパンアミド (本発明化合物31) 262 mg をメタノール4 ml に溶
かし、これにプロポキシアミン塩酸塩134 mg (1.2 mmol) およびピリジ
ン95 mg (1.2 mmol) を加えて、室温で8時間攪拌した。大部分のメタ
ノールを留去したのち、残さに酢酸エチルを加えて、希塩酸水、希重曹水および水
で順次洗浄した。有機層を乾燥したのち、濃縮した。残さをシリカゲル分取薄層
15 クロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル=2：1で展開) に付し、N-
メチル-3-{2-メチル-5-(1-プロポキシイミノ)エチル}フェニル-
2-(メトキシイミノ)プロパンアミド (本発明化合物153) 0.24 g (0.
75 mmol) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

20 δ (ppm) : 7.34–7.42 (2H, m)、7.10 (1H, d、 $J=8\text{ Hz}$)、
6.73 (1H, br)、4.12 (2H, t、 $J=7\text{ Hz}$)、3.97
(3H, s)、3.91 (2H, s)、2.87 (3H, d、 $J=5\text{ Hz}$)、
2.38 (3H, s)、2.17 (3H, s)、1.73 (2H, m)、0.9
7 (3H, t、 $J=7\text{ Hz}$)

25 製造例30

N-メチル-3-(5-アセチル-2-メチルフェニル)-2-(メトキシイ
ミノ)プロパンアミド (本発明化合物31) 262 mg をメタノール4 ml に溶
かし、ベンジルオキシアミン塩酸塩192 mg (1.2 mmol) およびピリジン
95 mg (1.2 mmol) を加えて、室温で3時間攪拌した。反応液をそのまま

シリカゲル分取薄層クロマトグラフィー（*n*-ヘキサン：酢酸エチル＝2：1で展開）に付し、*N*-メチル-3-〔5-（1-ベンジルオキシイミノ）エチル-2-メチル〕フェニル-2-（メトキシイミノ）プロパンアミド（本発明化合物164）0.28g（0.76mmol）を得た。

5 ¹H-NMR (CDCl₃, TMS)

δ (ppm) : 7.22-7.50 (7H, m)、7.10 (1H, d、J=8Hz)、6.70 (1H, br)、5.20 (2H, s)、3.94 (3H, s)、3.90 (2H, s)、2.85 (3H, d、J=6Hz)、2.38 (3H, s)、2.20 (3H, s)

10 製造例31

N-メチル-3-（5-アセチル-2-メチルフェニル）-2-（メトキシイミノ）プロパンアミド（本発明化合物31）262mgをメタノール4mlに溶かし、メトキシアミン塩酸塩100mg（1.2mmol）およびピリジン95mg（1.2mmol）を加えて、室温で3時間攪拌した。反応液をそのままシリカ

15 ゲル分取薄層クロマトグラフィー（*n*-ヘキサン：酢酸エチル＝2：1で展開）に付し、*N*-メチル-3-〔5-（1-メトキシイミノ）エチル-2-メチル〕フェニル-2-（メトキシイミノ）プロパンアミド（本発明化合物151）0.18g（0.62mmol）を得た。

¹H-NMR (CDCl₃, TMS)

20 δ (ppm) : 7.30-7.45 (2H, m)、7.11 (1H, d、J=8Hz)、6.73 (1H, br)、3.97 (3H, s)、3.96 (3H, s)、3.91 (2H, s)、2.86 (3H, d、J=5Hz)、2.38 (3H, s)、2.16 (3H, s)

製造例32

25 *N*-メチル-3-（5-ブロモ-2-メチル）フェニル-2-（メトキシイミノ）プロパンアミド1.12g（4.0mmol）、*o*-クレゾール865mg（8.0mmol）、よう化銅（I）19.0mg（0.10mmol）、炭酸セシウム2.61g（8.0mmol）、酢酸エチル17.6mg（0.20mmol）をトルエン（20ml）に加えた後、12時間加熱還流した。室温まで

冷却後、tert-ブチルメチルエーテルで希釈、水洗、乾燥（硫酸マグネシウム）した後、減圧下において濃縮した。残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー（1回目、n-ヘキサン：酢酸エチル＝3：1；2回目、n-ヘキサン：酢酸エチル＝10：1で溶出）に付し、N-メチル-3-〔2-メチル-5-（2-メチルフェノキシ）〕フェニル-2-（メトキシイミノ）プロパンアミド（本発明化合物57）491mg（1.51mmol）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm) : 6.95–7.25 (4H, m)、6.82 (1H, d、 $J=8\text{ Hz}$)、6.55–6.74 (3H, m)、3.89 (3H, s)、3.86 (2H, s)、2.85 (3H, d、 $J=5\text{ Hz}$)、2.33 (3H, s)、2.22 (3H, s)

製造例33

製造例20の方法に準じて、N-メチル-3-（5-ブロモ-2-メチルフェニル）-2-（メトキシイミノ）プロパンアミドと3-メトキシ-3-メチル-1-ブチンとを反応させN-メチル-3-〔2-メチル-5-（3-メトキシ-3-メチル-1-ブチニル）〕フェニル-2-（メトキシイミノ）プロパンアミド（本発明化合物351）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm) : 7.16 (1H, dd、 $J=8, 2\text{ Hz}$)、7.07 (1H, s)、7.04 (1H, d、 $J=8\text{ Hz}$)、6.75 (1H, br)、3.96 (3H, s)、3.86 (2H, s)、3.41 (3H, s)、2.89 (3H, d、 $J=5\text{ Hz}$)、2.37 (3H, s)、1.56 (3H, s)、1.52 (3H, s)

製造例34

製造例20の方法に準じて、N-メチル-3-（5-ブロモ-2-メチルフェニル）-2-（メトキシイミノ）プロパンアミドと3-エトキシ-3-メチル-1-ブチンとを反応させN-メチル-3-〔2-メチル-5-（3-エトキシ-3-メチル-1-ブチニル）〕フェニル-2-（メトキシイミノ）プロパンアミド（本発明化合物293）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm) : 7.16 (1H, dd、 $J=8$, 2Hz)、7.07 (1H, d、 $J=2$ Hz)、7.05 (1H, d、 $J=8$ Hz)、6.75 (1H, br)、3.97 (3H, s)、3.85 (2H, s)、3.65 (2H, q、 $J=8$ Hz) 2.88 (3H, d、 $J=5$ Hz)、2.37 (3H, s)、1.56 (3H, s)、1.52 (3H, s) 1.21 (3H, t、 $J=8$ Hz)

製造例 35

製造例 20 の方法に準じて、N-メチル-3-(5-ブロモ-2-メチルフェニル)-2-(メトキシイミノ)プロパンアミドと 3-メトキシ-3-エチル-1-ペンチンとを反応させ N-メチル-3-{2-メチル-5-(3-メトキシ-3-エチル-1-ペンチニル)}フェニル-2-(メトキシイミノ)プロパンアミド (本発明化合物 277) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm) : 7.17 (1H, dd、 $J=8$, 2Hz)、7.07 (1H, s)、7.04 (1H, d、 $J=8$ Hz)、6.74 (1H, br)、3.97 (3H, s)、3.86 (2H, s)、3.38 (3H, s)、2.89 (3H, d、 $J=5$ Hz)、2.38 (3H, s)、1.57 (4H, q、 $J=6$ Hz)、0.98 (6H, t、 $J=6$ Hz)

製造例 36

製造例 16 の方法に準じて、メチル 3-{5-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキソボロラニル)-2-メチル}フェニル-2-(メトキシイミノ)プロパノエートと 2-ブロモ-4-フェニルピリミジンを反応させ、メチル 3-{2-メチル-5-(4-フェニル-2-ピリミジニル)}フェニル-2-(メトキシイミノ)プロパノエート (本発明化合物 1365) を得た。

製造例 37

製造例 17 の方法に準じて、メチル 3-{2-メチル-5-(4-フェニル-2-ピリミジニル)}フェニル-2-メトキシイミノプロパノエートとメチルアミンの 40%メタノール溶液を反応させ、N-メチル-3-{2-メチル-5

ー（４－フェニル－２－ピリミジニル）} フェニル－２－（メトキシイミノ）プロパンアミド（本発明化合物３６５）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm) : 8. 79 (1 H, d、 $J=5\text{ Hz}$)、8. 34 (1 H, s)、8. 2
5 1～8. 30 (3 H, m)、7. 51～7. 55 (4 H, m)、7. 28 (1
H)、6. 77 (1 H, br)、4. 02 (5 H, s)、2. 88 (3 H, d,
 $J=5\text{ Hz}$)、2. 48 (3 H, s)

製造例 38

製造例 16 の方法に準じて、メチル 3－{5－（４、４、５、５－テトラメ
10 チル－１、３、２－ジオキソボロラニル）－２－メチル} フェニル－２－（メ
トキシイミノ）プロパノエートと２－ブromo－４－メチルピリミジンを反応させ、
メチル 3－{2－メチル－５－（４－メチル－２－ピリミジニル）} フェニル
－２－（メトキシイミノ）プロパノエート（本発明化合物 1368）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

15 δ (ppm) : 8. 60 (1 H, d)、8. 15～8. 22 (2 H, m)、7. 25
(1 H)、7. 00 (1 H)、4. 11 (3 H, s)、4. 01 (2 H, s)、
2. 58 (3 H, s)、2. 41 (3 H, s)

製造例 39

製造例 17 の方法に準じて、メチル 3－{2－メチル－５－（４－フェニル
20 －２－ピリミジニル）} フェニル－２－メトキシイミノプロパノエートとメチル
アミンの 40%メタノール溶液を反応させ、N－メチル－3－{2－メチル－５
－（２－ピリミジニル）} フェニル－２－（メトキシイミノ）プロパンアミド
（本発明化合物 368）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

25 δ (ppm) : 8. 59 (1 H, d、 $J=5\text{ Hz}$)、8. 18 (1 H, s)、8. 1
5 (1 H, d、 $J=8\text{ Hz}$)、7. 22 (1 H, d、 $J=8\text{ Hz}$)、6. 98
(1 H, d、 $J=5\text{ Hz}$)、6. 75 (1 H, br)、4. 00 (3 H, s)、
3. 99 (2 H, s)、2. 87 (3 H, d、 $J=5\text{ Hz}$)、2. 55 (3 H,
s)、2. 44 (3 H, s)

製造例 40

製造例 16 の方法に準じて、メチル 3- {5- (4, 4, 5, 5-テトラメ
チル-1, 3, 2-ジオキソボロラニル) -2-メチル} フェニル-2- (メト
キシイミノ) プロパノエートと 2-ブロモ-4-n-ブチルピリミジンとを反応さ
5 せ、メチル 3- {2-メチル-5- (4-n-ブチル-2-ピリミジニル) }
フェニル-2- (メトキシイミノ) プロパノエート (本発明化合物 1376) を
得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm) : 8.61 (1H, d, $J=5\text{Hz}$)、8.20 (1H, s)、8.1
10 8 (1H, d, $J=8\text{Hz}$)、7.25 (1H, d, $J=8\text{Hz}$)、6.97
(1H, d, $J=5\text{Hz}$)、4.11 (3H, s)、4.00 (2H, s)、3.
81 (3H, s)、2.78 (2H, t)、2.41 (3H, s)、1.77
(2H, quint)、1.42 (2H, sext)、0.97 (3H, t)

製造例 41

15 製造例 17 の方法に準じて、メチル 3- {2-メチル-5- (4-n-ブチ
ル-2-ピリミジニル) } フェニル-2-メトキシイミノプロパノエートとメチ
ルアミンの 40%メタノール溶液を反応させ、N-メチル-3- {2-メチル-
5- (4-n-ブチル-2-ピリミジニル) } フェニル-2- (メトキシイミ
ノ) プロパンアミド (本発明化合物 376) を得た。

20 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm) : 8.60 (1H, d, $J=5\text{Hz}$)、8.18 (1H, s)、8.1
5 (1H, d, $J=8\text{Hz}$)、7.22 (1H, d, $J=8\text{Hz}$)、6.96
(1H, d, $J=5\text{Hz}$)、6.73 (1H, br)、4.00 (3H, s)、
3.99 (2H, s)、2.86 (3H, d, $J=5\text{Hz}$)、2.78 (2H,
25 t)、2.44 (3H, s)、1.80 (2H, quint)、1.43 (2
H, sext)、0.97 (3H, t, $J=7\text{Hz}$)

製造例 42

製造例 16 の方法に準じて、メチル 3- {5- (4, 4, 5, 5-テトラメ
チル-1, 3, 2-ジオキソボロラニル) -2-メチル} フェニル-2- (メト

キシイミノ) プロパノエートと 2-ブロモ-4-sec-ブチルピリミジンを反応させ、メチル 3- {2-メチル-5- (4-sec-ブチル-2-ピリミジニル) } フェニル-2- (メトキシイミノ) プロパノエート (本発明化合物 1375) を得た。

5 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm) : 8.62 (1H, d, $J=5\text{ Hz}$)、8.22 (1H, s)、8.20 (1H, d)、7.25 (1H, d)、6.96 (1H, d, $J=5\text{ Hz}$)、4.11 (3H, s)、3.97 (2H, s)、3.81 (3H, s)、2.78 (1H, m)、2.41 (3H, s)、1.60~1.92 (2H, m)、
10 1.31 (3H, d, $J=7\text{ Hz}$)、0.88 (3H, t, $J=7\text{ Hz}$)

製造例 43

製造例 17 の方法に準じて、メチル 3- {2-メチル-5- (4-sec-ブチル-2-ピリミジニル) } フェニル-2-メトキシイミノプロパノエートとメチルアミンの 40%メタノール溶液を反応させ、N-メチル-3- {2-メチル-5- (4-sec-ブチル-2-ピリミジニル) } フェニル-2- (メトキシイミノ) プロパンアミド (本発明化合物 375) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm) : 8.61 (1H, d)、8.21 (1H, s)、8.18 (1H, d)、7.22 (1H, d)、6.96 (1H, d)、6.75 (1H, br)、
20 3.99 (5H, s)、2.86 (3H, d, $J=5\text{ Hz}$)、2.78 (1H, m)、2.45 (3H, s)、1.85 (1H, m)、1.67 (2H, m)、1.32 (3H, d)、0.88 (3H, t)

製造例 44

製造例 16 の方法に準じて、メチル 3- {5- (4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキソボロラニル) -2-メチル} フェニル-2- (メトキシイミノ) プロパノエートと 2-ブロモ-4-トリフルオロメチルピリミジンを反応させ、メチル 3- {2-メチル-5- (4-トリフルオロメチル-2-ピリミジニル) } フェニル-2- (メトキシイミノ) プロパノエート (本発明化合物 1370) を得た。

製造例 4 5

製造例 1 7 の方法に準じて、メチル 3- {2-メチル-5- (4-トリフル
オロメチル-2-ピリミジニル) } フェニル-2-メトキシイミノプロパノエー
トとメチルアミンの 40%メタノール溶液を反応させ、N-メチル-3- {2-
5 メチル-5- (4-トリフルオロメチル-2-ピリミジニル) } フェニル-2-
(メトキシイミノ) プロパンアミド (本発明化合物 3 7 0) を得た。

製造例 4 6

製造例 1 6 の方法に準じて、メチル 3- {5- (4, 4, 5, 5-テトラメ
チル-1, 3, 2-ジオキソボロラニル) -2-メチル} フェニル-2- (メト
10 キシイミノ) プロパノエートと 2-ブロモ-6-メチルピリジンを反応させ、メ
チル 3- {2-メチル-5- (6-メチル-2-ピリジニル) } フェニル-2-
- (メトキシイミノ) プロパノエート (本発明化合物 1 1 1 7) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm): 7. 7 5 (1 H, d d)、7. 6 5 (1 H, d)、7. 5 9 (1 H,
15 t)、7. 4 2 (1 H, d)、7. 2 3 (1 H, d)、7. 0 5 (1 H, d)、
4. 1 1 (3 H, s)、3. 9 8 (2 H, s)、3. 8 1 (3 H, s)、2. 3
9 (3 H, s)

製造例 4 7

製造例 1 7 の方法に準じて、メチル 3- {2-メチル-5- (6-メチル-
20 2-ピリジニル) } フェニル-2-メトキシイミノプロパノエートとメチルアミ
ンの 40%メタノール溶液を反応させ、N-メチル-3- {2-メチル-5-
(6-メチル-2-ピリジニル) } フェニル-2- (メトキシイミノ) プロパン
アミド (本発明化合物 1 1 7) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm): 7. 7 3 (1 H, d d)、7. 7 0 (1 H, d)、7. 5 9 (1 H,
25 t)、7. 4 2 (1 H, d)、7. 2 1 (1 H, d)、7. 0 4 (1 H, d)、
6. 7 4 (1 H, b r)、3. 9 9 (3 H, s)、3. 9 7 (2 H, s)、2.
8 6 (3 H, d)、2. 6 0 (3 H, s)、2. 4 3 (3 H, s)

製造例 4 8

製造例 16 の方法に準じて、メチル 3- {5- (4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキソボロラニル) -2-メチル} フェニル-2- (メトキシイミノ) プロパノエートと 2-ブロモ-6-クロロピリジンを反応させ、メチル 3- {2-メチル-5- (6-クロロ-2-ピリジニル) } フェニル-2- (メトキシイミノ) プロパノエート (本発明化合物 1118) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm) : 7.79 (1H, dd)、7.77 (1H, d)、7.64 (1H, t)、7.55 (1H, d)、7.24 (1H, d)、7.21 (1H, d)、4.12 (3H, s)、3.98 (2H, s)、3.82 (3H, s)、2.39 (3H, s)

製造例 49

製造例 17 の方法に準じて、メチル 3- {2-メチル-5- (6-クロロ-2-ピリジニル) } フェニル-2-メトキシイミノプロパノエートとメチルアミンの 40% メタノール溶液を反応させ、N-メチル-3- {2-メチル-5- (6-クロロ-2-ピリジニル) } フェニル-2- (メトキシイミノ) プロパンアミド (本発明化合物 1118) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

δ (ppm) : 7.76 (1H, dd)、7.73 (1H, s)、7.65 (1H, t)、7.56 (1H, d)、7.22 (1H, d)、7.20 (1H, d)、6.74 (1H, br)、4.01 (3H, s)、3.97 (2H, s)、2.87 (3H, d)、2.43 (3H, s)

製造例 50

製造例 16 の方法に準じて、メチル 3- {5- (4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキソボロラニル) -2-メチル} フェニル-2- (メトキシイミノ) プロパノエートと 2-ブロモ-6-トリフルオロメチルピリジンを反応させ、メチル 3- {2-メチル-5- (6-トリフルオロメチル-2-ピリジニル) } フェニル-2- (メトキシイミノ) プロパノエート (本発明化合物 1354) を得た。

製造例 51

製造例 17 の方法に準じて、メチル 3- {2-メチル-5- (6-トリフル
オロメチル-2-ピリジニル) } フェニル-2-メトキシイミノプロパノエート
とメチルアミンの 40%メタノール溶液を反応させ、N-メチル-3- {2-メ
チル-5- (6-トリフルオロメチル-2-ピリジニル) } フェニル-2- (メ
5 トキシイミノ) プロパンアミド (本発明化合物 354) を得た。

製造例 52

製造例 16 の方法に準じて、メチル 3- {5- (4, 4, 5, 5-テトラメ
チル-1, 3, 2-ジオキソボロラニル) -2-メチル} フェニル-2- (メト
キシイミノ) プロパノエートと 2-ブロモ-6-n-プロポキシピリジンを反応
10 させ、メチル 3- {2-メチル-5- (6-n-プロポキシ-2-ピリジニ
ル) } フェニル-2- (メトキシイミノ) プロパノエート (本発明化合物 135
6) を得た。

製造例 53

製造例 17 の方法に準じて、メチル 3- {2-メチル-5- (6-n-プロ
15 ポキシ-2-ピリジニル) } フェニル-2-メトキシイミノプロパノエートとメ
チルアミンの 40%メタノール溶液を反応させ、N-メチル-3- {2-メチル
-5- (6-n-プロポキシ-2-ピリジニル) } フェニル-2- (メトキシイ
ミノ) プロパンアミド (本発明化合物 356) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)

20 δ (ppm) : 7.72~7.78 (2H, m)、7.58 (1H, t)、7.24
(1H, d)、7.20 (1H, d)、6.74 (1H, br)、6.62 (1
H, d)、4.47 (2H, t)、3.98 (3H, s)、3.96 (2H,
s)、2.86 (3H, d)、2.43 (3H, s)、1.85 (2H, sex
t)、1.08 (3H, t)

25 次に、一般式 [10] で示される本発明化合物の例を化合物番号と共に表 1~
表 11 に示す。

式 [10]

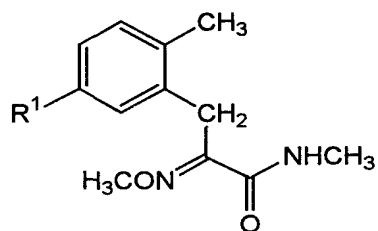


表 1

番号	R ¹	番号	R ¹
1	Ph	26	3-Ac-Ph
2	2-Me-Ph	27	4-Ac-Ph
3	3-Me-Ph	28	3-AcNH-Ph
4	4-Me-Ph	29	Me
5	2-Cl-Ph	30	HC(=O)
6	3-Cl-Ph	31	MeC(=O)
7	4-Cl-Ph	32	n-Bu
8	2-MeO-Ph	33	tert-Bu
9	3-MeO-Ph	34	n-Hex
10	4-MeO-Ph	35	c-Hex
11	2, 4-Me ₂ -Ph	36	シアノ
12	3, 4-Me ₂ -Ph	37	ClCH ₂
13	2, 4-Cl ₂ -Ph	38	BrCH ₂
14	3, 4-Cl ₂ -Ph	39	Cl
15	4-tert-Bu-Ph	40	Br
16	3-Br-Ph	41	I
17	4-Br-Ph	42	NO ₂
18	2-F-Ph	43	NH ₂
19	3-F-Ph	44	H ₂ C=CH
20	4-F-Ph	45	Me ₂ C=CH
21	4-Et-Ph	46	Me ₂ C=C(Me)
22	3-i-Pr-Ph	47	MeCH=C(Me)
23	2-CF ₃ -Ph	48	Me-OC(=O)
24	3-CF ₃ -Ph	49	1-ペンテニル
25	4-CF ₃ -Ph	50	1-ヘプテニル

表 2

番号	R ¹	番号	R ¹
51	1-オクテニル	76	4-Cl-PhO
52	PhCH ₂ CH ₂ =CH	77	2-Cl-PhS
53	Bn	78	3-Cl-PhS
54	PhCH=CH	79	4-Cl-PhS
55	PhO	80	2-MeO-PhS
56	PhS	81	3-MeO-PhS
57	2-Me-PhO	82	4-MeO-PhS
58	3-Me-PhO	83	PhOCH ₂
59	4-Me-PhO	84	2-Me-PhOCH ₂
60	PhCH=CH	85	3-Me-PhOCH ₂
61	PhOCH ₂	86	4-Me-PhOCH ₂
62	PhSCH ₂	87	Et ₃ CC≡C
63	BnO	88	Me ₃ SiC≡C
64	BnS	89	c-Hex-C≡C
65	2-Me-PhS	90	PhOC(Me) ₂ C≡C
66	3-Me-PhS	91	HOCH ₂
67	4-Me-PhS	92	4-NO ₂ -Ph
68	2-Me-BnO	93	4-CN-Ph
69	3-Me-BnO	94	3-CN-Ph
70	4-Me-BnO	95	2-CN-Ph
71	2-Me-BnS	96	4-EtO-Ph
72	3-Me-BnS	97	4-PhO-Ph
73	4-Me-BnS	98	3-PhO-Ph
74	2-Cl-PhO	99	4-CF ₃ O-Ph
75	3-Cl-PhO	100	HO

表 3

番号	R ¹	番号	R ¹
101	Py-2-イル	126	3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-イルオキシ
102	Py-3-イル	127	5-CF ₃ -Py-2-イルオキシ
103	Py-4-イル	128	ピリミジン-4-イルオキシ
104	2-チエニル	129	ピリミジン-2-イルオキシ
105	3-チエニル	130	6-Cl-ピリミジン-4-イルオキシ
106	2-フリル	131	5-Cl-Py-2-イルオキシ
107	3-フリル	132	アリルオキシ
108	2-ベンゾチエニル	133	プロパルギルオキシ
109	3-ベンゾチエニル	134	シクロプロピルメチルオキシ
110	2-ピリミジニル	135	i-PrO
111	4-ピリミジニル	136	tert-BuO
112	1-ピラゾリル	137	BnN(Me)
113	5-チアゾリル	138	3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-イルアミノ
114	5-オキサゾリル	139	5-CF ₃ -Py-2-イルアミノ
115	2-キノリル	140	ピリミジン-4-イルチオ
116	ピロール-1-イル	141	ピリミジン-2-イルチオ
117	6-Me-Py-2-イル	142	Py-2-イルチオ
118	6-Cl-Py-2-イル	143	5-CF ₃ -Py-2-イルチオ
119	3-Cl-Py-2-イル	144	3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-イルチオ
120	3-MeO-Py-2-イル	145	n-PrS
121	5-MeO-Py-2-イル	146	tert-BuS
122	3-Me-Py-2-イル	147	5-MeO-Py-2-イルチオ
123	ベンゾチアゾール-2-イルチオ	148	プロパルギルチオ
124	3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-イル	149	シクロプロピルメチルチオ
125	Py-2-イルオキシ	150	3,4-Me ₂ -PhS

表 4

番号	R ¹	番号	R ¹
151	Me ON=C (Me)	176	MeOCH ₂ CH ₂ ON=C(Me)
152	Et ON=C (Me)	177	EtOCH ₂ CH ₂ ON=C(Me)
153	n-Pr ON=C (Me)	178	PhCH ₂ CH ₂ ON=C(Me)
154	i-Pr ON=C (Me)	179	2,4-Cl ₂ -BnON=C(Me)
155	n-Bu ON=C (Me)	180	PhOCH ₂ CH ₂ ON=C(Me)
156	i-Bu ON=C (Me)	181	PhO(CH ₂) ₃ ON=C(Me)
157	sec-BuON=C(Me)	182	4-Me-Ph(CH ₂) ₂ ON=C(Me)
158	n-PentON=C(Me)	183	2-Me-Ph(CH ₂) ₂ ON=C(Me)
159	n-HexON=C(Me)	184	PhO(CH ₂) ₄ ON=C(Me)
160	tert-BuON=C(Me)	185	4-Me-PhO(CH ₂) ₂ ON=C(Me)
161	c-PrCH ₂ ON=C(Me)	186	2-Me-PhO(CH ₂) ₂ ON=C(Me)
162	c-PentCH ₂ ON=C(Me)	187	4-Cl-Ph(CH ₂) ₂ ON=C(Me)
163	Me ₃ CCH ₂ ON=C(Me)	188	2-Cl-Ph(CH ₂) ₂ ON=C(Me)
164	BnON=C(Me)	189	4-Me-PhCH(Me)ON=C(Me)
165	4-Me-BnON=C(Me)	190	2-Me-PhCH(Me)ON=C(Me)
166	3-Me-BnON=C(Me)	191	PhCH(Me)ON=C(Me)
167	2-Me-BnON=C(Me)	192	4-tert-Bu-BnON=C(Me)
168	3,4-Me ₂ -BnON=C(Me)	193	MeON=C(Me)CH ₂ ON=C(Me)
169	2,5-Me ₂ -BnON=C(Me)	194	PhON=C(Me)CH ₂ ON=C(Me)
170	2-Cl-BnON=C(Me)	195	PhCH(CN)ON=C(Me)
171	3-Cl-BnON=C(Me)	196	PhCH(MeO)ON=C(Me)
172	4-Cl-BnON=C(Me)	197	Ph-C(=O)-O
173	3,4-Cl ₂ -BnON=C(Me)	198	HON=C(Me)
174	HC=CCH ₂ ON=C(Me)	199	BnON=CH
175	H ₂ C=CHCH ₂ ON=C(Me)	200	5-クロロ-2-チエニル

表 5

番号	R ¹	番号	R ¹
201	MeSC(Me)=N	226	4-MeO-BnSC(Me)=N
202	MeC(=S)-NH	227	n-PrSC(Ph)=N
203	c-PrC(=S)-NH	228	i-BuSC(Me)=N
204	n-BuSC(Me)=N	229	BnSC(c-Pr)=N
205	MeSC(Et)=N	230	4-MeO-BnSC(SMe)=N
206	MeSC(n-Pr)=N	231	4-Cl-BnSC(SMe)=N
207	MeSC(c-Pr)=N	232	4-Me-BnSC(SMe)=N
208	BnSC(Me)=N	233	4-CF ₃ -BnSC(SMe)=N
209	BnSC(Et)=N	234	4-CF ₃ O-BnSC(SMe)=N
210	EtSC(Ph)=N	235	n-BuSC(SMe)=N
211	MeSC(SMe)=N	236	4-Cl-BnSC(=S)-NH
212	PhSC(SMe)=N	237	4-Me-BnSC(=S)-NH
213	BnSC(SMe)=N	238	4-CF ₃ -BnSC(=S)-NH
214	EtSC(SEt)=N	239	2-Me-BnSC(SMe)=N
215	BnSC(SMe)=N	240	4-Et-BnSC(SMe)=N
216	MeSC(=S)-NH	241	4-Cl-BnSC(S(c-Pr))=N
217	BnSC(=S)-NH	242	4-Me-BnSC(S(c-Pr))=N
218	4-Me-BnSC(c-Pr)=N	243	4-CF ₃ -BnSC(S(c-Pr))=N
219	MeSC(c-Pent)=N	244	4-CF ₃ O-BnSC(S(c-Pr))=N
220	MeSC(c-Hex)=N	245	4-MeO-BnSC(S(c-Pr))=N
221	4-MeO-BnSC(c-Pr)=N	246	MeOCH ₂ CH=C(Me)
222	4-Cl-BnSC(c-Pr)=N	247	EtOCH ₂ CH=C(Me)
223	BnSC(c-Pent)=N	248	PhCH=C(Me)
224	4-Me-BnSC(Me)=N	249	BnOCH=C(Me)
225	4-Cl-BnSC(Me)=N	250	4-Me-BnOCH=C(Me)

表 6

番号	R ¹
251	$\text{Et}_3\text{SiC}\equiv\text{C}$
252	$(i\text{-Pr})_3\text{SiC}\equiv\text{C}$
253	$\text{tert-BuMe}_2\text{SiC}\equiv\text{C}$
254	$\text{EtMe}_2\text{SiC}\equiv\text{C}$
255	$i\text{-PrMe}_2\text{SiC}\equiv\text{C}$
256	$\text{MeEt}_2\text{SiC}\equiv\text{C}$
257	$i\text{-PrEt}_2\text{SiC}\equiv\text{C}$
258	$c\text{-PrC}\equiv\text{C}$
259	$c\text{-PentC}\equiv\text{C}$
260	$2\text{-Cl-PhOC(Me)}_2\text{C}\equiv\text{C}$
261	$3\text{-Cl-PhOC(Me)}_2\text{C}\equiv\text{C}$
262	$4\text{-Cl-PhOC(Me)}_2\text{C}\equiv\text{C}$
263	$2\text{-Me-PhOC(Me)}_2\text{C}\equiv\text{C}$
264	$3\text{-Me-PhOC(Me)}_2\text{C}\equiv\text{C}$
265	$4\text{-Me-PhOC(Me)}_2\text{C}\equiv\text{C}$
266	$2\text{-MeO-PhOC(Me)}_2\text{C}\equiv\text{C}$
267	$3\text{-MeO-PhOC(Me)}_2\text{C}\equiv\text{C}$
268	$4\text{-MeO-PhOC(Me)}_2\text{C}\equiv\text{C}$
269	$\text{EtMe}_2\text{CC}\equiv\text{C}$
270	$n\text{-PrMe}_2\text{CC}\equiv\text{C}$
271	$i\text{-PrMe}_2\text{CC}\equiv\text{C}$
272	$n\text{-BuMe}_2\text{CC}\equiv\text{C}$
273	$i\text{-BuMe}_2\text{CC}\equiv\text{C}$
274	$\text{sec-BuMe}_2\text{CC}\equiv\text{C}$
275	$n\text{-PentMe}_2\text{CC}\equiv\text{C}$

表 7

番号	R ¹
276	Me Et ₂ CC≡C
277	(MeO) Et ₂ CC≡C
278	(EtO) Et ₂ CC≡C
279	PhMe ₂ CC≡C
280	2-Me-PhMe ₂ CC≡C
281	3-Me-PhMe ₂ CC≡C
282	4-Me-PhMe ₂ CC≡C
283	2-Cl-PhMe ₂ CC≡C
284	3-Cl-PhMe ₂ CC≡C
285	4-Cl-PhMe ₂ CC≡C
286	PhC≡C
287	2-Me-PhC≡C
288	2-Cl-PhC≡C
289	2-MeO-PhC≡C
290	HO C (Me) ₂ C≡C
291	PhCH ₂ C≡C
292	Ph(CH ₂) ₂ C≡C
293	(EtO) Me ₂ CC≡C
294	Me ₃ CC≡C
295	Me ₃ SiCH ₂ C≡C
296	Et ₃ SiCH ₂ C≡C
297	1-ヘキシニル
298	(MeO) EtMeCC≡C
299	4-Me-1-ペンチニル
300	3-Me-1-ペンチニル

表 8

番号	R ¹
301	PhMe ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
302	(2-Me-Ph) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
303	(3-Me-Ph) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
304	(4-Me-Ph) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
305	(2-Et-Ph) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
306	(3-Et-Ph) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
307	(4-Et-Ph) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
308	(2-MeO-Ph) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
309	(3-MeO-Ph) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
310	(4-MeO-Ph) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
311	(2-EtO-Ph) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
312	(3-EtO-Ph) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
313	(4-EtO-Ph) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
314	(2-Cl-Ph) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
315	(3-Cl-Ph) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
316	(4-Cl-Ph) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
317	EtMe ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
318	n-PrMe ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
319	n-BuMe ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
320	i-PrMe ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
321	i-BuMe ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
322	sec-BuMe ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
323	Et ₂ MeSiCH ₂ ON=C (Me)
324	Me ₃ SiCH ₂ ON=C (Me)
325	Et ₃ SiCH ₂ ON=C (Me)

表 9

番号	R ¹
326	n-PentMe ₂ SiCH ₂ ON=C(Me)
327	n-HexMe ₂ SiCH ₂ ON=C(Me)
328	EtMePhSiCH ₂ ON=C(Me)
329	n-BuMePhSiCH ₂ ON=C(Me)
330	n-PentMePhSiCH ₂ ON=C(Me)
331	n-HexMePhSiCH ₂ ON=C(Me)
332	Me ₂ PhSi(CH ₂) ₃ ON=C(Me)
333	Me ₂ PhSi(CH ₂) ₅ ON=C(Me)
334	Ph(CH ₂) ₂ Me ₂ SiCH ₂ ON=C(Me)
335	Ph(CH ₂) ₃ Me ₂ SiCH ₂ ON=C(Me)
336	(EtO)Me ₂ SiCH ₂ ON=C(Me)
337	(n-PrO)Me ₂ SiCH ₂ ON=C(Me)
338	(i-PrO)Me ₂ SiCH ₂ ON=C(Me)
339	(n-BuO)Me ₂ SiCH ₂ ON=C(Me)
340	(i-BuO)Me ₂ SiCH ₂ ON=C(Me)
341	(sec-BuO)Me ₂ SiCH ₂ ON=C(Me)
342	Me(i-PrO) ₂ SiCH ₂ ON=C(Me)
343	Me(i-BuO) ₂ SiCH ₂ ON=C(Me)
344	Me(sec-BuO) ₂ SiCH ₂ ON=C(Me)
345	Et(i-PrO) ₂ SiCH ₂ ON=C(Me)
346	Et(i-BuO) ₂ SiCH ₂ ON=C(Me)
347	Et(sec-BuO) ₂ SiCH ₂ ON=C(Me)
348	Me(c-HexO) ₂ SiCH ₂ ON=C(Me)
349	Me(n-HexO) ₂ SiCH ₂ ON=C(Me)
350	(4-EtO-Ph)(n-Pr)MeSiCH ₂ ON=C(Me)

表 10

番号	R ¹
351	Me ₂ (Me O) CC≡C
352	c-Bu C≡C
353	2-c-Pent-2-Me-1-エチニル
354	6-CF ₃ -Py-2-イル
355	2-n-PrO-Py-6-イル
356	2-BnO-Py-6-イル
357	6-Et-Py-2-イル
358	6-n-Pr-Py-2-イル
359	6-i-Pr-Py-2-イル
360	6-n-Bu-Py-2-イル
361	6-i-Bu-Py-2-イル
362	6-sec-Bu-Py-2-イル
363	6-tert-Bu-Py-2-イル
364	2-c-Pent-2-Et-1-エチニル
365	4-Ph-ピリミジン-2-イル
366	4-PhO-ピリミジン-2-イル
367	4-BnO-ピリミジン-2-イル
368	4-Me-ピリミジン-2-イル
369	4-Et-ピリミジン-2-イル
370	4-CF ₃ -ピリミジン-2-イル
371	4-MeO-ピリミジン-2-イル
372	4-CN-ピリミジン-2-イル
373	4-n-Pr-ピリミジン-2-イル
374	4-i-Pr-ピリミジン-2-イル
375	4-sec-Bu-ピリミジン-2-イル

表 1 1

番号	R ¹
376	4-n-Bu-ピリミジン-2-イル
377	4-i-Bu-ピリミジン-2-イル
378	4-t-Bu-ピリミジン-2-イル
379	4-n-Pent-ピリミジン-2-イル
380	4-n-Hex-ピリミジン-2-イル
381	4-n-Pr-ピリミジン-2-イル
382	6-Me-ピリミジン-4-イル
383	6-Et-ピリミジン-4-イル
384	6-n-Pr-ピリミジン-4-イル
385	6-i-Pr-ピリミジン-4-イル
386	6-n-Bu-ピリミジン-4-イル
387	4-MeO-ピリミジン-6-イル
388	4-PhO-ピリミジン-6-イル
389	4-BnO-ピリミジン-6-イル
390	4-EtO-ピリミジン-6-イル
391	4-n-PrO-ピリミジン-6-イル
392	6-n-Pent-Py-2-イル
393	6-n-Hex-Py-2-イル
394	ピラジン-2-イル
395	6-Me-ピラジン-2-イル
396	6-Et-ピラジン-2-イル
397	6-n-Pr-ピラジン-2-イル
398	6-n-Bu-ピラジン-2-イル
399	2-PhO-ピラジン-6-イル
400	2-BnO-ピラジン-6-イル

続いて、一般式 [11] で示される本発明化合物の例を化合物番号と共に表 1 2～表 2 2 に示す。

式 [1 1]

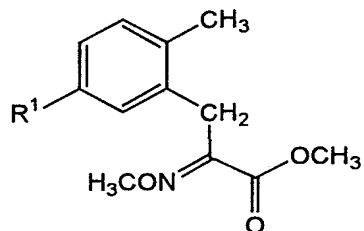


表 1 2

番号	R ¹	番号	R ¹
1001	Ph	1026	3-Ac-Ph
1002	2-Me-Ph	1027	4-Ac-Ph
1003	3-Me-Ph	1028	3-AcNH-Ph
1004	4-Me-Ph	1029	Me
1005	2-Cl-Ph	1030	HC (=O)
1006	3-Cl-Ph	1031	MeC (=O)
1007	4-Cl-Ph	1032	n-Bu
1008	2-MeO-Ph	1033	tert-Bu
1009	3-MeO-Ph	1034	n-Hex
1010	4-MeO-Ph	1035	c-Hex
1011	2, 4-Me ₂ -Ph	1036	シアノ
1012	3, 4-Me ₂ -Ph	1037	ClCH ₂
1013	2, 4-Cl ₂ -Ph	1038	BrCH ₂
1014	3, 4-Cl ₂ -Ph	1039	Cl
1015	4-tert-Bu-Ph	1040	Br
1016	3-Br-Ph	1041	I
1017	4-Br-Ph	1042	NO ₂
1018	2-F-Ph	1043	NH ₂
1019	3-F-Ph	1044	H ₂ C=CH
1020	4-F-Ph	1045	Me ₂ C=CH
1021	4-Et-Ph	1046	Me ₂ C=C (Me)
1022	3-i-Pr-Ph	1047	MeCH=C (Me)
1023	2-CF ₃ -Ph	1048	Me-OC (=O)
1024	3-CF ₃ -Ph	1049	1-ペンテニル
1025	4-CF ₃ -Ph	1050	1-ヘプテニル

表 1 3

番号	R ¹	番号	R ¹
1051	1-オクテニル	1076	4-Cl-PhO
1052	PhCH ₂ CH ₂ =CH	1077	2-Cl-PhS
1053	Bn	1078	3-Cl-PhS
1054	PhCH=CH	1079	4-Cl-PhS
1055	PhO	1080	2-MeO-PhS
1056	PhS	1081	3-MeO-PhS
1057	2-Me-PhO	1082	4-MeO-PhS
1058	3-Me-PhO	1083	PhOCH ₂
1059	4-Me-PhO	1084	2-Me-PhOCH ₂
1060	PhCH=CH	1085	3-Me-PhOCH ₂
1061	PhOCH ₂	1086	4-Me-PhOCH ₂
1062	PhSCH ₂	1087	Et ₃ CC≡C
1063	BnO	1088	Me ₃ SiC≡C
1064	BnS	1089	c-Hex-C≡C
1065	2-Me-PhS	1090	PhOC(Me) ₂ C≡C
1066	3-Me-PhS	1091	HOCH ₂
1067	4-Me-PhS	1092	4-NO ₂ -Ph
1068	2-Me-BnO	1093	4-CN-Ph
1069	3-Me-BnO	1094	3-CN-Ph
1070	4-Me-BnO	1095	2-CN-Ph
1071	2-Me-BnS	1096	4-EtO-Ph
1072	3-Me-BnS	1097	4-PhO-Ph
1073	4-Me-BnS	1098	3-PhO-Ph
1074	2-Cl-PhO	1099	4-CF ₃ O-Ph
1075	3-Cl-PhO	1100	HO

表 1 4

番号	R ¹		R ¹
1101	Py-2-イル	1126	3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-イルオキシ
1102	Py-3-イル	1127	5-CF ₃ -Py-2-イルオキシ
1103	Py-4-イル	1128	ピリミジン-4-イルオキシ
1104	2-チエニル	1129	ピリミジン-2-イルオキシ
1105	3-チエニル	1130	6-Cl-ピリミジン-4-イルオキシ
1106	2-フリル	1131	5-Cl-Py-2-イルオキシ
1107	3-フリル	1132	アリルオキシ
1108	2-ベンゾチエニル	1133	プロパルギルオキシ
1109	3-ベンゾチエニル	1134	シクロプロピルメチルオキシ
1110	2-ピリミジニル	1135	i-PrO
1111	4-ピリミジニル	1136	tert-BuO
1112	1-ピラゾリル	1137	BnN(Me)
1113	5-チアゾリル	1138	3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-イルアミノ
1114	5-オキサゾリル	1139	5-CF ₃ -Py-2-イルアミノ
1115	2-キノリル	1140	ピリミジン-4-イルチオ
1116	ピロール-1-イル	1141	ピリミジン-2-イルチオ
1117	6-Me-Py-2-イル	1142	Py-2-イルチオ
1118	6-Cl-Py-2-イル	1143	5-CF ₃ -Py-2-イルチオ
1119	3-Cl-Py-2-イル	1144	3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-イルチオ
1120	3-MeO-Py-2-イル	1145	n-PrS
1121	5-MeO-Py-2-イル	1146	tert-BuS
1122	3-Me-Py-2-イル	1147	5-MeO-Py-2-イルチオ
1123	ベンゾチアゾール-2-イルチオ	1148	プロパルギルチオ
1124	3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-イル	1149	シクロプロピルメチルチオ
1125	Py-2-イルオキシ	1150	3,4-Me ₂ -PhS

表 1 5

番号	R ¹	番号	R ¹
1151	MeON=C(Me)	1176	MeOCH ₂ CH ₂ ON=C(Me)
1152	EtON=C(Me)	1177	EtOCH ₂ CH ₂ ON=C(Me)
1153	n-PrON=C(Me)	1178	PhCH ₂ CH ₂ ON=C(Me)
1154	i-PrON=C(Me)	1179	2,4-Cl ₂ -BnON=C(Me)
1155	n-BuON=C(Me)	1180	PhOCH ₂ CH ₂ ON=C(Me)
1156	i-BuON=C(Me)	1181	PhO(CH ₂) ₃ ON=C(Me)
1157	sec-BuON=C(Me)	1182	4-Me-Ph(CH ₂) ₂ ON=C(Me)
1158	n-PentON=C(Me)	1183	2-Me-Ph(CH ₂) ₂ ON=C(Me)
1159	n-HexON=C(Me)	1184	PhO(CH ₂) ₄ ON=C(Me)
1160	tert-BuON=C(Me)	1185	4-Me-PhO(CH ₂) ₂ ON=C(Me)
1161	c-PrCH ₂ ON=C(Me)	1186	2-Me-PhO(CH ₂) ₂ ON=C(Me)
1162	c-PentCH ₂ ON=C(Me)	1187	4-Cl-Ph(CH ₂) ₂ ON=C(Me)
1163	Me ₃ CCH ₂ ON=C(Me)	1188	2-Cl-Ph(CH ₂) ₂ ON=C(Me)
1164	BnON=C(Me)	1189	4-Me-PhCH(Me)ON=C(Me)
1165	4-Me-BnON=C(Me)	1190	2-Me-PhCH(Me)ON=C(Me)
1166	3-Me-BnON=C(Me)	1191	PhCH(Me)ON=C(Me)
1167	2-Me-BnON=C(Me)	1192	4-tert-Bu-BnON=C(Me)
1168	3,4-Me ₂ -BnON=C(Me)	1193	MeON=C(Me)CH ₂ ON=C(Me)
1169	2,5-Me ₂ -BnON=C(Me)	1194	PhON=C(Me)CH ₂ ON=C(Me)
1170	2-Cl-BnON=C(Me)	1195	PhCH(CN)ON=C(Me)
1171	3-Cl-BnON=C(Me)	1196	PhCH(MeO)ON=C(Me)
1172	4-Cl-BnON=C(Me)	1197	Ph-C(=O)-O
1173	3,4-Cl ₂ -BnON=C(Me)	1198	HON=C(Me)
1174	HC=CCH ₂ ON=C(Me)	1199	BnON=CH
1175	H ₂ C=CHCH ₂ ON=C(Me)	1200	5-クロロ-2-チエニル

表 1 6

番号	R ¹	番号	R ¹
1201	MeSC(Me)=N	1226	4-MeO-BnSC(Me)=N
1202	MeC(=S)-NH	1227	n-PrSC(Ph)=N
1203	c-PrC(=S)-NH	1228	i-BuSC(Me)=N
1204	n-BuSC(Me)=N	1229	BnSC(c-Pr)=N
1205	MeSC(Et)=N	1230	4-MeO-BnSC(SMe)=N
1206	MeSC(n-Pr)=N	1231	4-Cl-BnSC(SMe)=N
1207	MeSC(c-Pr)=N	1232	4-Me-BnSC(SMe)=N
1208	BnSC(Me)=N	1233	4-CF ₃ -BnSC(SMe)=N
1209	BnSC(Et)=N	1234	4-CF ₃ O-BnSC(SMe)=N
1210	EtSC(Ph)=N	1235	n-BuSC(SMe)=N
1211	MeSC(SMe)=N	1236	4-Cl-BnSC(=S)-NH
1212	PhSC(SMe)=N	1237	4-Me-BnSC(=S)-NH
1213	BnSC(SMe)=N	1238	4-CF ₃ -BnSC(=S)-NH
1214	EtSC(SEt)=N	1239	2-Me-BnSC(SMe)=N
1215	BnSC(SMe)=N	1240	4-Et-BnSC(SMe)=N
1216	MeSC(=S)-NH	1241	4-Cl-BnSC(S(c-Pr))=N
1217	BnSC(=S)-NH	1242	4-Me-BnSC(S(c-Pr))=N
1218	4-Me-BnSC(c-Pr)=N	1243	4-CF ₃ -BnSC(S(c-Pr))=N
1219	MeSC(c-Pent)=N	1244	4-CF ₃ O-BnSC(S(c-Pr))=N
1220	MeSC(c-Hex)=N	1245	4-MeO-BnSC(S(c-Pr))=N
1221	4-MeO-BnSC(c-Pr)=N	1246	MeOCH ₂ CH=C(Me)
1222	4-Cl-BnSC(c-Pr)=N	1247	EtOCH ₂ CH=C(Me)
1223	BnSC(c-Pent)=N	1248	PhCH=C(Me)
1224	4-Me-BnSC(Me)=N	1249	BnOCH=C(Me)
1225	4-Cl-BnSC(Me)=N	1250	4-Me-BnOCH=C(Me)

表 1 7

番号	R ¹
1251	$\text{Et}_3\text{SiC}\equiv\text{C}$
1252	$\text{i-Pr}_3\text{SiC}\equiv\text{C}$
1253	$\text{tert-BuMe}_2\text{SiC}\equiv\text{C}$
1254	$\text{EtMe}_2\text{SiC}\equiv\text{C}$
1255	$\text{i-PrMe}_2\text{SiC}\equiv\text{C}$
1256	$\text{MeEt}_2\text{SiC}\equiv\text{C}$
1257	$\text{i-PrEt}_2\text{SiC}\equiv\text{C}$
1258	$\text{c-PrC}\equiv\text{C}$
1259	$\text{c-PentC}\equiv\text{C}$
1260	$2\text{-Cl-PhOC(Me)}_2\text{C}\equiv\text{C}$
1261	$3\text{-Cl-PhOC(Me)}_2\text{C}\equiv\text{C}$
1262	$4\text{-Cl-PhOC(Me)}_2\text{C}\equiv\text{C}$
1263	$2\text{-Me-PhOC(Me)}_2\text{C}\equiv\text{C}$
1264	$3\text{-Me-PhOC(Me)}_2\text{C}\equiv\text{C}$
1265	$4\text{-Me-PhOC(Me)}_2\text{C}\equiv\text{C}$
1266	$2\text{-MeO-PhOC(Me)}_2\text{C}\equiv\text{C}$
1267	$3\text{-MeO-PhOC(Me)}_2\text{C}\equiv\text{C}$
1268	$4\text{-MeO-PhOC(Me)}_2\text{C}\equiv\text{C}$
1269	$\text{EtMe}_2\text{CC}\equiv\text{C}$
1270	$\text{n-PrMe}_2\text{CC}\equiv\text{C}$
1271	$\text{i-PrMe}_2\text{CC}\equiv\text{C}$
1272	$\text{n-BuMe}_2\text{CC}\equiv\text{C}$
1273	$\text{i-BuMe}_2\text{CC}\equiv\text{C}$
1274	$\text{sec-BuMe}_2\text{CC}\equiv\text{C}$
1275	$\text{n-PentMe}_2\text{CC}\equiv\text{C}$

表 1 8

番号	R ¹
1276	Me Et ₂ CC≡C
1277	(MeO) Et ₂ CC≡C
1278	(EtO) Et ₂ CC≡C
1279	PhMe ₂ CC≡C
1280	2-Me-PhMe ₂ CC≡C
1281	3-Me-PhMe ₂ CC≡C
1282	4-Me-PhMe ₂ CC≡C
1283	2-Cl-PhMe ₂ CC≡C
1284	3-Cl-PhMe ₂ CC≡C
1285	4-Cl-PhMe ₂ CC≡C
1286	PhC≡C
1287	2-Me-PhC≡C
1288	2-Cl-PhC≡C
1289	2-MeO-PhC≡C
1290	HOC (Me) ₂ C≡C
1291	PhCH ₂ C≡C
1292	Ph (CH ₂) ₂ C≡C
1293	(EtO) Me ₂ CC≡C
1294	Me ₃ CC≡C
1295	Me ₃ SiCH ₂ C≡C
1296	Et ₃ SiCH ₂ C≡C
1297	1-ヘキシニル
1298	(MeO) EtMeCC≡C
1299	4-Me-1-ペンチニル
1300	3-Me-1-ペンチニル

表 1 9

番号	R ¹
1301	PhMe ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1302	(2-Me-Ph) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1303	(3-Me-Ph) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1304	(4-Me-Ph) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1305	(2-Et-Ph) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1306	(3-Et-Ph) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1307	(4-Et-Ph) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1308	(2-MeO-Ph) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1309	(3-MeO-Ph) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1310	(4-MeO-Ph) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1311	(2-EtO-Ph) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1312	(3-EtO-Ph) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1313	(4-EtO-Ph) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1314	(2-Cl-Ph) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1315	(3-Cl-Ph) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1316	(4-Cl-Ph) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1317	EtMe ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1318	n-PrMe ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1319	n-BuMe ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1320	i-PrMe ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1321	i-BuMe ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1322	sec-BuMe ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1323	Et ₂ MeSiCH ₂ ON=C (Me)
1324	Me ₃ SiCH ₂ ON=C (Me)
1325	Et ₃ SiCH ₂ ON=C (Me)

表 2 0

番号	R ¹
1326	n-PentMe ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1327	n-HexMe ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1328	EtMePhSiCH ₂ ON=C (Me)
1329	n-BuMePhSiCH ₂ ON=C (Me)
1330	n-PentMePhSiCH ₂ ON=C (Me)
1331	n-HexMePhSiCH ₂ ON=C (Me)
1332	Me ₂ PhSi (CH ₂) ₃ ON=C (Me)
1333	Me ₂ PhSi (CH ₂) ₅ ON=C (Me)
1334	Ph (CH ₂) ₂ Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1335	Ph (CH ₂) ₃ Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1336	(EtO) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1337	(n-PrO) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1338	(i-PrO) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1339	(n-BuO) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1340	(i-BuO) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1341	(sec-BuO) Me ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1342	Me (i-PrO) ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1343	Me (i-BuO) ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1344	Me (sec-BuO) ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1345	Et (i-PrO) ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1346	Et (i-BuO) ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1347	Et (sec-BuO) ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1348	Me (c-HexO) ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1349	Me (n-HexO) ₂ SiCH ₂ ON=C (Me)
1350	(4-EtO-Ph) (n-Pr) MeSiCH ₂ ON=C (Me)

表 2 1

番号	R ¹
1351	Me ₂ (Me O) CC≡C
1352	2-c-Bu-1-エチニル
1353	2-c-Pent-2-Me-1-エチニル
1354	6-CF ₃ -Py-2-イル
1355	6-PhO-Py-2-イル
1356	6-n-PrO-Py-2-イル
1357	6-Et-Py-2-イル
1358	6-n-Pr-Py-2-イル
1359	6-i-Pr-Py-2-イル
1360	6-n-Bu-Py-2-イル
1361	6-i-Bu-Py-2-イル
1362	6-sec-Bu-Py-2-イル
1363	6-tert-Bu-Py-2-イル
1364	2-c-Pent-2-Et-1-エチニル
1365	4-Ph-ピリミジン-2-イル
1366	4-PhO-ピリミジン-2-イル
1367	4-BnO-ピリミジン-2-イル
1368	4-Me-ピリミジン-2-イル
1369	4-Et-ピリミジン-2-イル
1370	4-CF ₃ -ピリミジン-2-イル
1371	4-MeO-ピリミジン-2-イル
1372	4-CN-ピリミジン-2-イル
1373	4-n-Pr-ピリミジン-2-イル
1374	4-i-Pr-ピリミジン-2-イル
1375	4-sec-Bu-ピリミジン-2-イル

表 2 2

番号	R ¹
1376	4-n-Bu-ピリミジン-2-イル
1377	4-i-Bu-ピリミジン-2-イル
1378	4-t-Bu-ピリミジン-2-イル
1379	4-n-Pent-ピリミジン-2-イル
1380	4-n-Hex-ピリミジン-2-イル
1381	4-n-Pr-ピリミジン-2-イル
1382	6-Me-ピリミジン-4-イル
1383	6-Et-ピリミジン-4-イル
1384	6-n-Pr-ピリミジン-4-イル
1385	6-i-Pr-ピリミジン-4-イル
1386	6-n-Bu-ピリミジン-4-イル
1387	4-MeO-ピリミジン-6-イル
1388	4-PhO-ピリミジン-6-イル
1389	4-BnO-ピリミジン-6-イル
1390	4-EtO-ピリミジン-6-イル
1391	4-n-PrO-ピリミジン-6-イル
1392	6-n-Pent-Py-2-イル
1393	6-n-Hex-Py-2-イル
1394	ピラジン-2-イル
1395	6-Me-ピラジン-2-イル
1396	6-Et-ピラジン-2-イル
1397	6-n-Pr-ピラジン-2-イル
1398	6-n-Bu-ピラジン-2-イル
1399	2-PhO-ピラジン-6-イル
1400	2-BnO-ピラジン-6-イル

尚、上記の表において、Meはメチル基を、Etはエチル基を、n-Prはプロピル基を、i-Prはイソプロピル基を、c-Prはシクロプロピル基を、n

- Buはブチル基を、i—Buはイソブチル基を、tert—Buはtert—ブチル基を、sec—Buはsec—ブチル基を、c—Buはシクロブチル基を、n—Pentはペンチル基を、c—Pentはシクロペンチル基を、n—Hexはヘキシル基を、c—Hexはシクロヘキシル基を、Phはフェニル基を、Pyはピリジル基を、Bnはベンジル基を、Acはアセチル基を、CNはシアノ基を意味する。

次に製剤例を示す。なお、部は重量部を表わし、本発明化合物は前記表1～表22に記載の化合物番号で示す。

製剤例1

- 10 本発明化合物1～400、1001～1400の各々50部、リグニンスルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部及び合成含水酸化珪素45部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤を得る。

製剤例2

- 15 本発明化合物1～400、1001～1400の各々25部、ポリオキシエチレンソルビタンモノオレエート3部、CMC3部及び水69部を混合し、有効成分の粒度が5ミクロン以下になるまで湿式粉碎することにより、各々のフロアブル剤を得る。

製剤例3

- 20 本発明化合物1～400、1001～1400の各々2部、カオリンクレー8部及びタルク10部をよく粉碎混合することにより、各々の粉剤を得る。

製剤例4

本発明化合物1～400、1001～1400の各々20部、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル14部、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム6部及びキシレン60部をよく混合することにより、各々の乳剤を得る。

25 製剤例5

本発明化合物1～400、1001～1400の各々2部、合成含水酸化珪素1部、リグニンスルホン酸カルシウム2部、ベントナイト30部及びカオリンクレー65部をよく粉碎混合し、水を加えてよく練り合せた後、造粒乾燥することにより、各々の粒剤を得る。

製剤例 6

- 本発明化合物 1～400、1001～1400 の各々 20 部とソルビタントリオレート 1.5 部とを、ポリビニルアルコール 2 部を含む水溶液 28.5 部と混合し、サンドグライNDERで微粉碎（粒径 3 μ 以下）した後、この中に、キサンタンガム 0.05 部及びアルミニウムマグネシウムシリケート 0.1 部を含む水溶液 40 部を加え、さらにプロピレングリコール 10 部を加えて攪拌混合し各々の 20 % 水中フロアブル剤を得る。

製剤例 7

- 本発明化合物 1～400、1001～1400 の各々 20 部とソルビタントリオレート 1.5 部とを、ポリビニルアルコール 2 部を含む水溶液 28.5 部と混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中に、キサンタンガム 0.05 部及びアルミニウムマグネシウムシリケート 0.1 部を含む水溶液 40 部を加え、さらにプロピレングリコール 10 部を加えて攪拌混合し各々のフロアブル剤を得る。

製剤例 8

- 本発明化合物 1～400、1001～1400 の各々 5 部、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル 14 部、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム 6 部及びキシレン 75 部をよく混合することにより、各々の乳剤を得る。

製剤例 9

- 本発明化合物 1～400、1001～1400 の各々 10 部、ポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩 50 部を含むホワイトカーボン 35 部、及び水 55 部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々のフロアブル剤を得る。

製剤例 10

- 本発明化合物 1～400、1001～1400 の各々 0.1 部をキシレン 5 部およびトリクロロエタン 5 部に溶解し、これを脱臭灯油 89.9 部に混合して各々の 0.1 % 油剤を得る。

製剤例 11

本発明化合物 1～400、1001～1400 の各々 0.1 部、トリクロロエタン 10 部および脱臭灯油 59.9 部を混合溶解し、エアゾール容器に充填し、バルブ部

分を取り付けた後、該バルブ部分を通じて噴射剤(液化石油ガス)30部を加圧充填して各々の油性エアゾールを得る。

製剤例 1 2

- 5 本発明化合物 1～400、1001～1400の各々0.2部、キシレン5部、脱臭灯油4.8部および乳化剤{アトモス300(アトラスケミカル社製)}1部を混合溶解したものと、純水50部とをエアゾール容器に充填し、バルブ部分を取り付けた後、該バルブ部分を通じて噴射剤(液化石油ガス)40部を加圧充填して各々の水性エアゾールを得る。

- 次に、本発明化合物が農園芸用殺菌剤および殺虫・殺ダニ剤として有用であることを試験例で示す。なお、本発明化合物は表1～表22に記載の化合物番号で示す。

本発明化合物の防除効果は、調査時の供試植物上の病斑の面積を肉眼観察し、無処理区の病斑の面積と本発明化合物処理区の病斑の面積を比較することにより評価した。

- 15 試験例 1 : イネいもち病防除試験 (予防効果)

- プラスチックポットに砂壤土を詰め、イネ(日本晴)を播種し、温室内で20日間生育させた。その後、本発明化合物 1、2、4、5、7、12、14、15、19、20、25、88、110、151、153、164、251、275、286、291、294、1001、1007、1088、1110、1251、365、1368、368、1376、376、1375、375、1370、370、1117、117、118、354、1356、356および1294の各々を製剤例2に準じてフロアブル剤とした後、水で希釈し所定濃度(500 ppm)にし、それを、そのイネ葉面に充分付着するように茎葉散布した。散布後、植物を風乾し、いもち病菌のフロアブル液を噴霧接種した。接種後28℃、多湿下に6日間置いた後、防除効果を調査した。その結果、本発明化合物 1、2、4、5、7、12、14、15、19、20、25、88、110、151、153、164、251、275、286、291、294、1001、1007、1088、1110、1251、365、1368、368、1376、376、1375、375、1370、370、1117、117、118、35

4、1 3 5 6、3 5 6および1 2 9 4 処理区の植物上の病斑面積は、無処理区の病斑面積の10%以下であった。

試験例2：コムギうどんこ病防除試験（治療効果）

プラスチックポットに砂壤土を詰め、コムギ（農林73号）を播種し、温室内で
5 10日間生育させた。第2葉が展開したそのコムギの幼苗にコムギうどんこ病菌胞子をふりかけ接種した。接種後、23℃の温室に2日間置いた。本発明化合物1、2、4、5、7、12、14、19、20、25、88、151、164、251、286、1001、1007、1088および1251の各々を製剤例2に準じてフロアブル剤とした後、水で希釈し所定濃度(500ppm)にし、それを、う
10 どんこ病菌が接種されているコムギ葉面に充分付着するように茎葉散布した。散布後さらに照明下に7日間置いた後、防除効果を調査した。その結果、本発明化合物1、2、4、5、7、12、14、19、20、25、88、151、164、251、286、1001、1007、1088および1251処理区の植物上の病斑面積は、無処理区の病斑面積の10%以下であった。

15 試験例3：コムギさび病防除試験（予防効果）

プラスチックポットに砂壤土を詰め、コムギ（農林73号）を播種し、温室内で
10日間生育させた。本発明化合物1、2、4、5、7、12、14、15、19、20、88、110、151、153、164、251、275、286、291、294、1001、1007、1088、1110、1251、36
20 5、1368、368、1376、376、1375、375、1370、370、1117、117、118、354、1356、356および1253の各々を製剤例2に準じてフロアブル剤とした後、水で希釈し所定濃度(500ppm)にし、それを、そのコムギ葉面に充分付着するように茎葉散布した。散布後植物を風乾し、コムギ赤さび病菌の胞子を接種した。接種後はじめは23℃、暗黒多湿下
25 に1日置き、さらに照明下に6日間置いた後、防除効果を調査した。その結果、本発明化合物1、2、4、5、7、12、14、15、19、20、88、110、151、153、164、251、275、286、291、294、1001、1007、1088、1110、1251、365、1368、368、1376、376、1375、375、1370、370、1117、117、

1 1 8、3 5 4、1 3 5 6、3 5 6および1 2 5 3処理区の植物上の病斑面積は、無処理区の病斑面積の10%以下であった。

試験例4：コムギふ枯れ病防除試験（予防効果）

プラスチックポットに砂壤土を詰め、コムギ（農林73号）を播種し、温室内で
5 10日間生育させた。本発明化合物1、2、4、5、7、12、19、20、88、110、151、153、164、275、286、291、294、1001、1370、117、354、356および1110の各々を製剤例2に準じてフロアブル剤とした後、水で希釈し所定濃度(500ppm)にし、それを、そのコムギ葉面に充分付着するように茎葉散布した。散布後植物を風乾し、コムギふ枯
10 れ病菌の孢子フロアブル液を噴霧接種した。接種後はじめは15℃、暗黒多湿下に4日置き、さらに照明下に7日間置いた後、防除効果を調査した。その結果、本発明化合物1、2、4、5、7、12、19、20、88、110、151、153、164、275、286、291、294、1001、1370、117、354、356および1110処理区の植物上の病斑面積は、無処理区の病斑面
15 積の10%以下であった。

試験例5：コムギ眼紋病防除試験（予防効果）

プラスチックポットに砂壤土を詰め、コムギ（農林73号）を播種し、温室内で
10日間生育させた。本発明化合物1、4、5、7、12、15、19、20、25、88、110、151、153、164、286、294、1251、3
20 51、370、118、356および1253の各々を製剤例2に準じてフロアブル剤とした後、水で希釈し所定濃度(500ppm)にし、それを、そのコムギ葉面に充分付着するように茎葉散布した。散布後植物を風乾し、コムギ眼紋病菌の孢子含有マッシュポテトを株元に接種した。接種後はじめは15℃、暗黒多湿下に7日間置き、さらに照明下に4日間置いた後、防除効果を調査した。その結果、本発
25 明化合物1、4、5、7、12、15、19、20、25、88、110、151、153、164、286、294、1251、351、370、118、356および1253処理区の植物上の病斑面積は、無処理区の病斑面積の10%以下であった。

試験例6：ブドウべと病防除効果試験（予防効果）

プラスチックポットに砂壤土を詰め、ブドウ（ベリーA）を播種し、温室内で40日間生育させた。本発明化合物1、2、4、5、7、12、14、15、19、20、25、88、110、153、164、251、275、286、291、294、1001、1088、1110、1251、1253、351、1368、368、1376、376、1375、370、118および1294の各々を製剤例2に準じてフロアブル剤とした後、水で希釈し所定濃度(200ppm)にし、それを、そのブドウ葉面に充分付着するように茎葉散布した。散布後植物を風乾し、ブドウべと病の遊走子嚢フロアブル液を噴霧接種した。接種後はじめは23℃、多湿下に1日置き、さらに温室内で6日間置いた後、防除効果を調査した。その結果、本発明化合物1、2、4、5、7、12、14、15、19、20、25、88、110、153、164、251、275、286、291、294、1001、1088、1110、1251、1253、351、1368、368、1376、376、1375、370、118および1294処理区の植物上の病斑面積は、無処理区の病斑面積の10%以下であった。

15 試験例7：キュウリ灰色かび病防除効果試験（予防効果）

プラスチックポットに砂壤土を詰め、キュウリ（相模半白）を播種し、温室内で12日間生育させた。本発明化合物1、2、4、7、12、14、151、153、164、286、294、1001、1007、1088、1251、118および1294の各々を製剤例2に準じてフロアブル剤とした後、水で希釈し所定濃度(500ppm)にし、それを、そのキュウリ葉面に充分付着するように茎葉散布した。散布後植物を風乾し、キュウリ灰色かび病菌の菌糸含有PDA培地をキュウリ葉面上に置いた。接種後10℃、多湿下に4日間置いた後、防除効果を調査した。その結果、本発明化合物1、2、4、7、12、14、151、153、164、286、294、1001、1007、1088、1251、118および1294処理区の植物上の病斑面積は、無処理区の病斑面積の10%以下であった。

試験例8：キュウリうどんこ病防除効果試験（予防効果）

プラスチックポットに砂壤土を詰め、キュウリ（相模半白）を播種し、温室内で12日間生育させた。本発明化合物1、2、4、5、7、12、14、19、2

0、25、88、151、164、251、275、286、294、1001、1007、1088、1251、368、1376、370、354および1294の各々を製剤例2に準じてフロアブル剤とした後、水で希釈し所定濃度(200ppm)にし、それを、そのキュウリ葉面に充分付着するように茎葉散布した。

- 5 散布後植物を風乾し、キュウリうどんこ病菌の胞子を接種した。接種後23℃下に12日間置いた後、防除効果を調査した。その結果、本発明化合物1、2、4、5、7、12、14、19、20、25、88、151、164、251、275、286、294、1001、1007、1088、1251、368、1376、370、354および1294処理区の植物上の病斑面積は、無処理区の
- 10 病斑面積の10%以下であった。

試験例9：コムギうどんこ病防除効果試験（予防効果）

- プラスチックポットに砂壤土を詰め、コムギ（農林73号）を播種し、温室内で10日間生育させた。本発明化合物110、153、275、291、294、1110、1253、351、365、1368、368、1376、376、1
- 15 375、375、1370、1117、117、118、354、1356、356および1294の各々を製剤例9に準じてフロアブル剤とした後、水で希釈し所定濃度(500ppm)にし、それを、そのコムギ葉面に充分付着するように茎葉散布した。散布後植物を風乾し、1日後にコムギうどんこ病菌の胞子をふりかけ接種した。接種後、照明下に7日間置いた後、防除効果を調査した。その結果、本
- 20 発明化合物110、153、275、291、294、1110、1253、351、365、1368、368、1376、376、1375、375、1370、1117、117、118、354、1356、356および1294処理区の植物上の病斑面積は、無処理区の病斑面積の10%以下であった。

試験例10：ナミハダニ(*Tetranychus urticae*)に対する殺ダニ試験

- 25 播種7日後のプラスチックカップ植えのツルナシインゲン（初生葉期）に、約20頭のナミハダニ雌成虫を放し、1日間放置後、製剤例9に準じて得られた本発明化合物251、1251および1253の各々のフロアブル剤の水希釈液(500ppm)20mlを散布処理した。8日後に防除効果を以下の基準で判定した。

－：ほとんど被害無く、生存虫なし。

±：わずかに被害がある。少数の生存虫あり。

＋：被害、生存虫とも、無処理よりやや少ない。

++：無処理と同等。

その結果、本発明化合物 2 5 1、1 2 5 1 および 1 2 5 3 の防除効果は一であった。

試験例 1 1：トビイロウンカ（灌注）

プラスチックポットに砂壤土を詰め、イネ（日本晴れ）を播種し、温室内で 20 日間成育させた。その後、本発明化合物 1 2 5 3 を製剤例 9 に準じてフロアブル剤とした後、水で希釈し所定濃度（500ppm）にし、それを、そのイネ葉面に充分付着するように茎葉散布した。散布後、植物を風乾し、トビイロウンカ幼虫を約 30 頭放した。放虫後 6 日間温室においた後、その生死を調査したところ死虫率 80%以上を示した。

試験例 1 2：イエバエ (*Musca domestica*) に対する殺虫試験

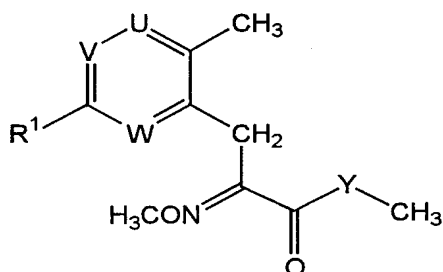
直径 5.5 cm のポリエチレンカップの底に同大のろ紙を敷き、製剤例 9 に準じて得られた本発明化合物 2 5 1 のフロアブル剤の水希釈液（500 ppm）0.7 ml をろ紙上に滴下し、餌としてショ糖約 30 mg を均一に入れた。その中にイエバエ雌成虫 10 頭を放ち、蓋をして 1 日後にその生死を調査し、死虫率を求めた。その結果、本発明化合物 2 5 1 は死虫率 80%以上を示した。

発明の効果

本発明化合物は、優れた植物病害防除効力および殺虫、殺ダニ効力を有する。

請求の範囲

1. 一般式 [1] :



[式中、R¹はハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、置換されていてもよいC 1
 ～C 10アルキル基、置換されていてもよいC 3～C 10シクロアルキル基、置
 5 換されていてもよいC 5～C 10シクロアルケニル基、置換されていてもよいC
 6あるいはC 10アリール基、置換されていてもよいC 1～C 9ヘテロアリール
 基、A¹-L¹-基、A¹-C≡C-基、A¹C (A²) =C (A³)-基、A¹-O
 N=CA²-基、A¹-ON=C (Me) CH₂ON=CA²-基、A¹C (A²) =
 NOCH₂-基、A¹SC (A²) =N-基、A¹C (=S) NH-基、A¹SC
 10 (=S) NH-基、A¹SC (SA²) =N-基、A¹-ON=C (CN)-基、
 A¹-ON=C (Me) CH₂ON=C (CN)-基またはA¹C (CN) =NO
 CH₂-基を表わし

{ここで、L¹は酸素原子、硫黄原子、カルボニル基、-OCH₂-基、-SCH
 2-基、-C (=O) O-基、-OC (=O) -基、-C (=O) OCH₂-基、
 15 -NH-基またはC 1～C 6アルキルイミノ基を表わし、

A¹、A²及びA³は同一または相異なり、水素原子、置換されていてもよいC 1
 ～C 10アルキル基、置換されていてもよいC 2～C 10アルケニル基、置換さ
 れていてもよいC 2～C 10アルキニル基、置換されていてもよいC 3～C 10
 シクロアルキル基、置換されていてもよいC 5～C 10シクロアルケニル基、置
 20 換されていてもよいC 6あるいはC 10アリール基、置換されていてもよいC 7
 ～C 19アリールアルキル基、置換されていてもよいC 1～C 9ヘテロアリール
 基、置換されていてもよいC 2～C 19ヘテロアリールアルキル基、置換されて
 いてもよいC 3～C 20トリアルキルシリル基、置換されていてもよいC 8～C
 20ジアルキルアリールシリル基あるいは置換されていてもよいC 3～C 20ジ

アルキルアルコキシシリル基を表わす。}、

UおよびVの内、一つは CR^2 基を表わし、他の一つはCH基または窒素原子を表わし、Wは CR^3 基または窒素原子を表わし

- {ここで、 R^2 、 R^3 は同一または相異なり、水素原子、ハロゲン原子、C1～C6アルキル基、C1～C6アルコキシ基、C1～C6ハロアルキル基、C1～C6ハロアルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C2～C6アルコキシカルボニル基、C1～C6アルキルチオ基またはC1～C6ハロアルキルチオ基を表わす。}、

Yは酸素原子またはNH基を表わす。]

- 10 で示されるオキシム誘導体。

2. 上記一般式[1]で示されるオキシム誘導体における R^1 、 A^1 、 A^2 および A^3 において、

- 置換されていてもよいC1～C10アルキル基、置換されていてもよいC2～C10アルケニル基、置換されていてもよいC2～C10アルキニル基、置換されていてもよいC3～C10シクロアルキル基、置換されていてもよいC5～C10シクロアルケニル基、置換されていてもよいC1～C9ヘテロアリール基、置換されていてもよいC2～C19ヘテロアリールアルキル基、置換されていてもよいC3～C9トリアルキルシリル基、C8～C20ジアルキルアリールシリル基および置換されていてもよいC3～C20ジアルキルアルコキシシリル基における各置換基が、同一または相異なり、下記a群からなる群より選ばれる1種以上の基であり、

- 置換されていてもよいC6あるいはC10アリール基および置換されていてもよいC7～C19アリールアルキル基における各置換基が、同一または相異なり、下記a群およびb群からなる群より選ばれる1種以上の基である請求項1に記載のオキシム誘導体：

a 群：

ハロゲン原子、C1～C10アルキル基、C1～C10ハロアルキル基、C3～C10シクロアルキル基、C1～C10アルコキシ基、C1～C10ハロアルコキシ基、C1～C10アルキルチオ基、C1～C10ハロアルキルチオ基、C

- 2～C10アルコキシカルボニル基、C2～C10アルキルカルボニル基、C2～C10アルキルアミノ基、C2～C10アルキルアミノカルボニル基、C2～C10アルキルカルボニルアミノ基、フェニル基、フェノキシ基、ベンジルオキシ基、フェノキシメチル基、ヘテロアリール基、ヘテロアリールオキシ基、
- 5 ヘテロアリールメトキシ基、ヘテロアリールオキシメチル基 {ここで、該フェニル基、フェノキシ基、ベンジルオキシ基、フェノキシメチル基、ヘテロアリール基、ヘテロアリールオキシ基、ヘテロアリールメトキシ基およびヘテロアリールオキシメチル基の各々は、ハロゲン原子、C1～C6アルキル基、C1～C6アルコキシ基、C1～C6ハロアルキル基、C1～C6ハロアルコキシ基、C1～
- 10 C6アルキルチオ基、C1～C6ハロアルキルチオ基およびシアノ基からなる群より選ばれる1種以上の基で置換されていてもよい。}、C3～C20トリアルキルシリル基、C8～C20ジアルキルアリールシリル基、C3～C20ジアルキルアルコキシシリル基、C3～C20アルキルジアルコキシシリル基、C7～C20アルキルジシクロアルコキシシリル基、水酸基、シアノ基およびニトロ
- 15 基；

b群：

メチレンジオキシ基およびジフルオロメチレンジオキシ基 {ここで、該メチレンジオキシ基およびジフルオロメチレンジオキシ基の各々は、アリール部位における隣接する二つの炭素原子に結合する。}。

- 20 3. 上記一般式〔1〕において、UおよびVの内、一つがCR²基であり、他の一つがCH基であり、WがCR³基である {R²、R³は前記と同じ意味を表わす。} 請求項1または2に記載のオキシム誘導体。

4. 上記一般式〔1〕で示されるオキシム誘導体において、R²、R³が同一または相異なり、水素原子、ハロゲン原子またはメチル基である請求項1、2または
- 25 は3に記載のオキシム誘導体。

5. 上記一般式〔1〕で示されるオキシム誘導体において、U、V及びWがCH基である請求項1または2に記載のオキシム誘導体。

6. 上記一般式〔1〕において、R¹が置換されていてもよいC6あるいはC10アリール基、置換されていてもよいC1～C9ヘテロアリール基、A¹－L¹

一基、 $A^1-C\equiv C$ —基または $A^1-ON=CA^2$ —基である { A^1 および L^1 は前記と同じ意味を表わし、 A^2 はメチル基を表わす。} 請求項 1～5 のいずれかに記載のオキシム誘導体。

7. 上記一般式 [1] において、 R^1 が置換されていてもよい C_6 あるいは C_{10} アリール基である請求項 1～5 のいずれかに記載のオキシム誘導体。

8. 上記一般式 [1] において、 R^1 が置換されていてもよい $C_1\sim C_9$ ヘテロアリール基である請求項 1～5 のいずれかに記載のオキシム誘導体。

9. 上記一般式 [1] において、 R^1 が $A^1-C\equiv C$ —基である { A^1 は前記と同じ意味を表わす。} 請求項 1～5 のいずれかに記載のオキシム誘導体。

10. 10. 上記一般式 [1] において、 R^1 が $A^1-ON=CA^2$ —基 (A^1 及び A^2 は前記と同じ意味を表わす。) である請求項 1～5 のいずれかに記載のオキシム誘導体。

11. 上記一般式 [1] において、 R^1 が $A^1-ON=C(Me)$ —基 (A^1 は前記と同じ意味を表わす。) である請求項 1～5 のいずれかに記載のオキシム誘導体。

12. 上記一般式 [1] において、 R^1 が A^1-L^1 —基 (A^1 および L^1 は前記と同じ意味を表わす。) である請求項 1～5 のいずれかに記載のオキシム誘導体。

13. 上記一般式 [1] において、 A^1 は置換されていてもよい C_6 あるいは C_{10} アリール基または置換されていてもよい $C_1\sim C_9$ ヘテロアリール基を表わし、 L^1 は酸素原子である請求項 12 に記載のオキシム誘導体。

14. 上記一般式 [1] において、 Y が NH 基である請求項 1～13 のいずれかに記載のオキシム誘導体。

15. 上記一般式 [1] において、 Y が酸素原子である請求項 1～13 のいずれかに記載のオキシム誘導体。

16. 請求項 1～15 のいずれかに記載のオキシム誘導体を有効成分として含有することを特徴とする農園芸用殺菌剤。

17. 請求項 1～15 のいずれかに記載のオキシム誘導体を有効成分として含有することを特徴とする殺虫、殺ダニ剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP00/00060

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl.⁷ C07C251/40, C07F7/10, C07D213/56, C07D213/61, C07D213/65, C07D213/64, C07D213/55, C07D307/52, C07D231/12, C07D215/12, C07D333/24, C07D333/60, C07D333/28, C07D239/26, C07D263/32, C07D207/325, C07D277/30, C07D277/70, A01N37/50, A01N43/40, A01N43/54, A01N55/00

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl.⁷ C07C251/40, C07F7/10, C07D213/56, C07D213/61, C07D213/65, C07D213/64, C07D213/55, C07D307/52, C07D231/12, C07D215/12, C07D333/24, C07D333/60, C07D333/28, C07D239/26, C07D263/32, C07D207/325, C07D277/30, C07D277/70, A01N37/50, A01N43/40, A01N43/54, A01N55/00

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
CAPLUS (STN) , REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO, 98/45254, A2 (SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED), 15 October, 1998 (15.10.98) & JP, 10-338668, A	1-17
A	US, 5354779, A (Bayer Aktiengesellschaft), 11 October, 1994 (11.10.94) & JP, 5-279310, A & EP, 546387, A1	1-17
A	US, 5312960, A (Bayer Aktiengesellschaft), 17 May, 1994 (17.05.94) & JP, 4-230252, A & EP, 464381, A2	1-17



Further documents are listed in the continuation of Box C.



See patent family annex.

* Special categories of cited documents:
 "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
 "E" earlier document but published on or after the international filing date
 "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
 "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
 "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
 "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
 "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
 "&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
13 April, 2000 (13.04.00)

Date of mailing of the international search report
25 April, 2000 (25.04.00)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC)) Int. Cl. ⁷ C07C251/40, C07F7/10, C07D213/56, C07D213/61, C07D213/65, C07D213/64, C07D213/55, C07D307/52, C07D231/12, C07D215/12, C07D333/24, C07D333/60, C07D333/28, C07D239/26, C07D263/32, C07D207/325, C07D277/30, C07D277/70, A01N37/50, A01N43/40, A01N43/54, A01N55/00		
B. 調査を行った分野 調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC)) Int. Cl. ⁷ C07C251/40, C07F7/10, C07D213/56, C07D213/61, C07D213/65, C07D213/64, C07D213/55, C07D307/52, C07D231/12, C07D215/12, C07D333/24, C07D333/60, C07D333/28, C07D239/26, C07D263/32, C07D207/325, C07D277/30, C07D277/70, A01N37/50, A01N43/40, A01N43/54, A01N55/00		
最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの		
国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語) CAPLUS (STN), REGISTRY (STN)		
C. 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	WO, 98/45254, A2 (SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED) 15. 10月. 1998 (15. 10. 98) &JP, 10-338668, A	1 ~ 17
A	US, 5354779, A (Bayer Aktiengesellschaft) 11. 10月. 1994 (11. 10. 94) &JP, 5-279310, A &EP, 546387, A1	1 ~ 17
A	US, 5312960, A (Bayer Aktiengesellschaft) 17. 5月. 1994 (17. 05. 94) &JP, 4-230252, A &EP, 464381. A2	1 ~ 17
<input type="checkbox"/> C欄の続きにも文献が列挙されている。 <input type="checkbox"/> パテントファミリーに関する別紙を参照。		
* 引用文献のカテゴリー 「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの 「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの 「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す) 「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献 「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願日の後に公表された文献 「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの 「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの 「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの 「&」 同一パテントファミリー文献		
国際調査を完了した日 13. 04. 00	国際調査報告の発送日 25.04.00	
国際調査機関の名称及びあて先 日本国特許庁 (ISA/J P) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 本堂 裕司 電話番号 03-3581-1101 内線 3443	4H 9049 